

(4H, m), 3.81 (3H, s), 4.73 (2H, s), 5.43 (2H, s), 7.15 (1H, s), 7.50 (1H, s), 7.53 (1H, s), 8.06 (1H, s), 8.36 (1H, q, J=4.0Hz).

MS: m/e (ESI) 524.3 (MH⁺)

実施例 1044

5 1-[3-第 3 プチル-4-メトキシ-5-[(2-メトキシエチル)-メチルアミノ]-フェニル]-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

10 1.29 (3H, t, J=6.8Hz), 1.36 (9H, s), 1.39 (3H, t, J=6.8Hz), 2.81 (3H, s), 3.18 (3H, s), 3.22-3.44 (4H, m), 3.81 (3H, s), 4.11 (2H, q, J=6.8Hz), 4.20 (2H, q, J=6.8Hz), 4.79 (2H, s), 5.49 (2H, s), 7.34 (1H, s), 7.50 (1H, d, J=2.0Hz), 7.52 (1H, d, J=2.0Hz).

実施例 1045

15 1-(3-第 3 プチル-4-エトキシ-5-モルフォリノ-フェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

20 1.29 (3H, t, J=7.0Hz), 1.34-1.42 (15H, m), 3.00 (4H, brs), 3.79 (4H, brs), 4.01 (2H, q, J=7.0Hz), 4.21 (2H, q, J=7.0Hz), 4.29 (2H, q, J=7.0Hz), 4.79 (2H, s), 5.47 (2H, s), 7.34 (1H, s), 7.47 (1H, d, J=2.0Hz), 7.61 (1H, d, J=2.0Hz), 9.02 (13H, brs), 9.27 (1H, brs)

MS: m/e (ESI) 542.3 (MH⁺)

実施例 1046

25 2-[2-(3-第 3 プチル-4-エトキシ-5-モルフォリノ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 34-1. 43 (15H, m), 2. 83 (3H, d, J=4. 6Hz), 3. 00 (4H, brs), 3. 79 (4H, brs), 4. 25-4. 32 (4H, m), 4. 83 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 49 (1H, s), 7. 53 (1H, s), 7. 62 (1H, s), 8. 20 (1H, q, J=4. 6Hz), 8. 55 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 537. 4 (MH+)

5 実施例 1047

1-[3-第3ブチル-5-(2-ヒドロキシエチルアミノ)-4-メトキシフェニル]-2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 塩酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

10 1. 38 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 45 (9H, s), 1. 50 (3H, t, J=6. 8Hz), 3. 44 (2H, t, J=5. 4Hz), 3. 83 (2H, t, J=5. 4Hz), 3. 89 (3H, s), 4. 18 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 24 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 91 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 21 (1H, s), 7. 55 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 66 (1H, d, J=2. 0Hz).

MS:m/e (ESI) 502. 3 (MH+)

実施例 1048

1-[3-第3ブチル-5-(2-ヒドロキシエチルアミノ)-4-メトキシフェニル]-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 2 塩酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

20 1. 44 (9H, s), 3. 38 (2H, t, J=5. 6Hz), 3. 83 (2H, t, J=5. 6Hz), 3. 86 (3H, s), 3. 94 (3H, s), 4. 02 (3H, s), 4. 91 (2H, s), 5. 46 (2H, s), 7. 25 (1H, s), 7. 40 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 54 (1H, d, J=2. 0Hz).

実施例 1049

1-{3-第3ブチル-5-[(2-ヒドロキシエチル)-メチルアミノ]-4-メトキシフェニル}-2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 2 塩酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 36 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 44 (9H, s), 1. 49 (3H, t, J=6. 8Hz), 3. 04 (3H, brs), 3. 38-3. 75 (4H, m), 3. 95 (3H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 21 (1H, s), 7. 77-7. 95 (2H, m).

MS:m/e (ESI) 516. 4 (MH+)

実施例 1050

5 酢酸 2-(3-第 3 プチル-5-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル}-メチルアミノ)-エチル エステル; 塩酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

10 1. 27 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 36 (9H, s), 1. 39 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 87 (3H, s), 2. 81 (3H, s), 2. 72-2. 85 (2H, m), 3. 38 (2H, t, J=6. 0Hz), 3. 81 (3H, s), 4. 12 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 20 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 79 (2H, s), 5. 55 (2H, s), 7. 33 (1H, s), 7. 52 (1H, s), 7. 54 (1H, s), 9. 07 (1H, brs), 9. 44 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 558. 4 (MH+)

実施例 1051

15 2-[2-[3-第 3 プチル-5-(3, 4-ジヒドロキシピロリジン-1-イル)-4-メトキシフェニル]-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド; トリフルオロ酢酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

20 1. 37 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 2. 88-2. 95 (2H, m), 3. 50-3. 59 (2H, m), 3. 61 (3H, s), 4. 02 (2H, brs), 4. 28 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 83 (2H, s), 5. 37-5. 60 (2H, m), 7. 29 (1H, s), 7. 38 (1H, s), 7. 54 (1H, s), 8. 12-8. 28 (1H, m), 8. 55 (1H, s), 9. 14 (1H, brs), 9. 82 (1H, brs).

実施例 1052

25 1-[3-第 3 プチル-5-(3, 4-ジヒドロキシピロリジン-1-イル)-4-メトキシフェニル]-2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; トリフルオロ酢酸塩

1H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 87-2. 97 (2H, m), 3. 48-3.
58 (2H, m), 3. 61 (3H, s), 4. 02 (2H, brs), 4. 11 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 21 (2H, q, J=6. 8Hz), 4
. 78 (2H, s), 5. 36-5. 58 (2H, m), 7. 28 (1H, s), 7. 34 (1H, s), 7. 37 (1H, s), 9. 04 (1H, brs),
5 9. 26 (1H, brs).

実施例 1053

2-[2-[3-第 3 ブチル-5-((3R, 4R)-3-ヒドロキシ-4-メトキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド; トリフルオロ酢酸塩

10 1H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 37 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 82 (3H, d, J=4. 4Hz), 2. 82-3. 11 (2H, m), 3. 30 (3H
, s), 3. 40-3. 58 (2H, m), 3. 63 (3H, s), 3. 72-3. 79 (1H, m), 4. 10-4. 25 (1H, m), 4. 27 (2H, q
, J=6. 8Hz), 4. 83 (2H, s), 5. 38-5. 62 (2H, m), 7. 32 (1H, s), 7. 42 (1H, s), 7. 54 (1H, s), 8.
14-8. 28 (1H, m), 8. 55 (1H, s), 9. 13 (1H, brs), 9. 83 (1H, brs).

実施例 1054

1-[3-第 3 ブチル-5-((3R, 4R)-3-ヒドロキシ-4-メトキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-1-イソインドール-2-イル)-エタノン; トリフルオロ酢酸塩

1H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 29 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 39 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 91-2. 99 (1H, m), 3. 03-3.
12 (1H, m), 3. 30 (3H, s), 3. 40-3. 58 (2H, m), 3. 63 (3H, s), 3. 71-3. 79 (1H, m), 4. 10 (2H, q
, J=7. 2Hz), 4. 10-4. 30 (3H, m), 4. 78 (2H, s), 5. 38-5. 60 (2H, m), 7. 30 (1H, s), 7. 33 (1H,
s), 7. 41 (1H, s), 8. 99-9. 12 (1H, m), 9. 20-9. 40 (1H, m).

実施例 1055

25 6-(2-{3-第 3 ブチル-5-[(2-ヒドロキシエチル)メチルアミノ]-4-メトキシ-フェニル}-2-オキソ-エチル)-3-エトキシ-7-イミノ-6, 7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3, 4-b]

ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;塩酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 26-1. 44 (3H, m), 1. 36 (9H, s), 2. 77 (3H, d, J=4. 0Hz), 2. 81 (3H, s), 3. 17 (2H, t, J=6. 4 Hz), 3. 52 (2H, t, J=6. 4Hz), 3. 82 (3H, s), 4. 23 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 87 (2H, s), 5. 60 (2H, s), 7. 51-7. 53 (2H, m), 8. 00 (1H, s), 8. 57 (1H, q, J=4. 0Hz), 9. 57 (1H, brs), 9. 97 (1H, br s).

実施例 1056

2-(2-{3-第3ブチル-5-[(2-ヒドロキシエチル)-メチルアミノ]-4-メトキシフェニル}-2-オキソ-エチル)-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;塩酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 36 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 75-2. 90 (3H, m), 3. 06-3. 26 (2H, m), 3. 14 (3H, s), 3. 54 (2H, t, J=4. 0Hz), 3. 82 (3H, s), 4. 26 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 83 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 7. 45-7. 60 (3H, m), 8. 20 (1H, q, J=4. 0Hz), 8. 55 (1H, s), 9. 33 (1H, brs), 9. 91 (1H, brs).

実施例 1057

({3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-1イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル}-メチルアミノ)-アセトニトリル;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 29 (3H, t, J=7Hz), 1. 35-1. 42 (12H, m), 2. 87 (3H, s), 3. 80 (3H, s), 4. 11 (2H, q, J=7Hz), 4. 21 (2H, q, J=7Hz), 4. 36 (2H, s), 4. 81 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 7. 35 (1H, brs), 7. 58 (1H, brs), 7. 66 (1H, brs), 9. 06 (1H, brs), 9. 32 (1H, brs).

実施例 1058

2-{2-[3-第3ブチル-5-(シアノメチル-アミノ)-4-メトキシフェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1.35-1.42 (12H, m), 2.81 (3H, d, J=5Hz), 3.71 (3H, s), 4.24-4.38 (4H, m), 4.84 (2H, s),
5.46 (2H, s), 6.05 (1H, m), 7.30 (1H, brs), 7.39 (1H, brs), 7.50 (1H, brs), 8.23 (1H, m),
8.52 (1H, s).

5 MS:m/e (ESI) 492.2 (MH+)

実施例 1059

{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニルアミノ}-アセトニトリル;
臭化水素酸塩

10 1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1.29 (3H, t, J=7Hz), 1.35-1.42 (12H, m), 3.72 (3H, s), 4.11 (2H, q, J=7Hz), 4.21 (2H, q,
J=7Hz), 4.36 (2H, m), 4.81 (2H, s), 5.49 (2H, s), 6.15 (1H, m), 7.32 (1H, brs), 7.34 (1H,
brs), 7.39 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 497.2 (MH+)

15 実施例 1060

2-{2-[3-第3ブチル-5-(シアノメチル-メチルアミノ)-4-メトキシフェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

20 1.35-1.42 (12H, m), 2.82 (3H, d, J=5Hz), 2.87 (3H, s), 3.81 (3H, s), 4.25-4.37 (4H, m),
4.85 (2H, s), 5.53 (2H, s), 7.54 (1H, brs), 7.58 (1H, brs), 7.67 (1H, brs), 8.20 (1H, m),
8.55 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 506.2 (MH+)

実施例 1061

25 1-(3-第3ブチル-4-メトキシメトキシ-5-モロフォリン-4-イル-フェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-

イル)-エタノン;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 29 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 37-1. 43 (15H, m), 2. 94 (4H, brs), 3. 54 (3H, s), 3. 79 (4H, brs)
, 4. 11 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 21 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 77 (2H, s), 5. 34 (2H, s), 5. 45 (2H, s),
5 7. 32 (1H, s), 7. 52 (1H, s), 7. 64 (1H, s), 9. 02 (1H, brs), 9. 27 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 558. 3 (MH+)

実施例 1062

2-[2-[3-第 3 ブチル-5-((3R, 4R)-3-ヒドロキシ-4-メトキシ-ピロリジン-1-イ
ル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2, 3-
ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 36 (9H, s), 2. 77 (3H, d, J=4. 0Hz), 2. 85-3. 14 (8H, m), 3. 29 (3H, s), 3. 62 (3H, s), 3. 70
-3. 80 (1H, m), 4. 13-4. 27 (1H, m), 4. 72 (2H, s), 5. 35-5. 60 (2H, m), 7. 15 (1H, s), 7. 31 (1
H, s), 7. 41 (1H, s), 8. 05 (1H, s), 8. 30-8. 44 (1H, m), 8. 90 (1H, brs), 9. 52 (1H, brs).

実施例 1063

6-[2-[3-第 3 ブチル-5-((3R, 4R)-3-ヒドロキシ-4-メトキシ-ピロリジン-1-イ
ル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6, 7-ジヒド
ロ-5H-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

20 1. 26-1. 54 (12H, m), 2. 77 (3H, d, J=4. 8Hz), 2. 70-3. 01 (1H, m), 3. 02-3. 13 (1H, m), 3. 30
(3H, s), 3. 40-3. 58 (2H, m), 3. 63 (3H, s), 3. 71-3. 82 (1H, m), 4. 10-4. 45 (3H, m), 4. 87 (2
H, s), 5. 23 (1H, d, J=3. 6Hz), 5. 40-5. 70 (2H, m), 7. 31 (1H, s), 7. 42 (1H, s), 7. 99 (1H, s)
, 8. 40-8. 63 (1H, m), 9. 28-9. 48 (2H, m).

実施例 1064

2-[2-(3-第 3 ブチル-4-メトキシメトキシ-5-モルフォリノ-フェニル)-2-オキソ-
エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸

メチルアミド;臭化水素酸塩1H-NMR(DMSO-d₆) δ :

1. 40-1. 43(12H, m), 2. 82(3H, d, J=4. 8Hz), 2. 95(4H, brs), 3. 55(3H, s), 3. 79(4H, brs)
 , 4. 28(2H, q, J=7. 0Hz), 4. 85(2H, s), 5. 34(2H, s), 5. 49(2H, s), 7. 52-7. 54(2H, m), 7. 6
 5(1H, s), 8. 21(1H, d, J=4. 8Hz), 9. 16(1H, brs), 9. 85(1H, brs).

MS:m/e(ESI) 553. 3(MH⁺)

実施例 1065

1-(3-第3ブチル-4-ヒドロキシ-5-モルフォリノ-フェニル)-2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;塩酸塩1H-NMR(DMSO-d₆) δ :

1. 29(3H, t, J=7. 0Hz), 1. 38-1. 41(12H, m), 2. 78-2. 79(4H, m), 3. 81-3. 83(4H, m), 4. 11
 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 21(2H, q, J=7. 0Hz), 4. 79(2H, s), 5. 44(2H, s), 7. 33(1H, s), 7. 67(1H, s), 7. 73(1H, s), 9. 03(1H, brs), 9. 20(1H, brs), 9. 28(1H, brs).

MS:m/e(ESI) 514. 3(MH⁺)

実施例 1066

2-[2-(3-第3ブチル-4-ヒドロキシ-5-モルフォリノ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩1H-NMR(DMSO-d₆) δ :

1. 40-1. 43(12H, m), 2. 77-2. 80(4H, m), 2. 82(3H, d, J=4. 4Hz), 3. 81-3. 83(4H, m), 4. 28(2H, q, J=7. 0Hz), 4. 84(2H, s), 5. 45(2H, s), 7. 54(1H, s), 7. 68(1H, s), 7. 74(1H, s), 8. 21(1H, q, J=4. 4Hz), 8. 56(1H, s), 9. 14(1H, brs), 9. 20(1H, brs), 9. 82(1H, brs).

MS:m/e(ESI) 509. 3(MH⁺)

実施例 1067

2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-1-(3-イソプロピル-4-メトキシ-5-モルフォリノ-フェニル)-エタノン;臭化

水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 20 (6H, d, J=6. 8Hz), 1. 29 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 40 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 90-3. 10 (5H, m)
 , 3. 66-3. 88 (4H, m), 3. 87 (3H, s), 4. 04-4. 26 (4H, m), 4. 80 (2H, s), 5. 50 (2H, s), 7. 34 (1
 5 H, s), 7. 39 (1H, s), 7. 58 (1H, s), 9. 06 (1H, brs), 9. 34 (1H, brs).

実施例 1068

2-(2-{3-第 3 プチル-5-[エチル-(2-ヒドロキシエチル)-アミノ]-4-メトキシ-フ
エニル}-2-オキソ-エチル)-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインド
ール-5-カルボン酸メチルアミド; 塩酸塩

10 1H-NMR (DMSO-d6) δ :

0. 96 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 36 (9H, s), 1. 42 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 82 (3H, d, J=4. 0Hz), 3. 12
 -3. 28 (4H, m), 3. 20-3. 65 (2H, m), 3. 84 (3H, s), 4. 27 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 4
 9 (2H, s), 7. 48-7. 60 (3H, m), 8. 21 (1H, brs), 8. 56 (1H, s), 9. 21 (1H, brs), 9. 86 (1H, brs
).

15 MS:m/e (ESI) 525. 3 (MH+)

実施例 1069

2-(2-{3-第 3 プチル-5-[エチル-(2-ヒドロキシエチル)-アミノ]-4-メトキシ-フ
エニル}-2-オキソ-エチル)-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソ
インドール-5-カルボン酸メチルアミド; 塩酸塩

20 1H-NMR (DMSO-d6) δ :

0. 95 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 36 (9H, s), 2. 77 (3H, d, J=4. 0Hz), 2. 91 (6H, s), 3. 08-3. 18 (4H
 , m), 3. 47 (2H, t, J=5. 6Hz), 3. 84 (3H, s), 4. 73 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 14 (1H, s), 7. 53 (1H, s), 7. 55 (1H, s), 8. 08 (1H, s), 3. 37 (1H, q, J=4. 0Hz), 9. 08 (1H, brs), 9. 60 (1H, brs)

25 実施例 1070

1-{3-第 3 プチル-5-[エチル-(2-ヒドロキシエチル)-アミノ]-4-メトキシ-フエニ

ル]-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-1ソインドール-2-イル)-アセチル;塩酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

0. 96 (3H, t, J=6. 4Hz), 1. 28 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 39 (3H, t, J=6. 8Hz), 3. 14
 5 -3. 26 (4H, m), 3. 47 (2H, t, J=6. 0Hz), 3. 84 (3H, s), 4. 11 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 20 (2H, q, J
 =6. 8Hz), 4. 79 (2H, s), 5. 61 (2H, s), 7. 33 (1H, s), 7. 55 (1H, s), 7. 60 (1H, s), 9. 10 (1H, b
 rs), 9. 57 (1H, brs).

実施例 1071

6-(2-{3-第3ブチル-5-[エチル-(2-ヒドロキシエチル)-アミノ]-4-メトキシフェニル}-2-オキソ-エチル)-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;塩酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

0. 96 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 36 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 36 (9H, s), 2. 78 (3H, d, J=4. 0Hz), 3. 14
 -3. 28 (4H, m), 3. 30-3. 64 (2H, m), 3. 84 (3H, s), 4. 24 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 88 (2H, s), 5. 5
 15 6 (2H, s), 7. 53 (1H, s), 7. 55 (1H, s), 8. 00 (1H, s), 8. 55 (1H, q, J=4. 0Hz), 9. 49 (1H, brs)
 , 9. 96 (1H, brs).

実施例 1072

2-{2-[3-第3ブチル-5-(4-ヒドロキシ-4-メチル-ピペリジン-1-イル)-4-メトキシフェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソイソドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 18 (3H, s), 1. 36 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 57-1. 76 (4H, m), 2. 82 (3H, d, J=4. 8
 Hz), 2. 90-3. 07 (4H, m), 3. 93 (3H, s), 4. 16-4. 37 (3H, m), 4. 83 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 5
 3 (1H, s), 7. 55 (1H, s), 7. 56 (1H, s), 8. 10-8. 26 (1H, m), 8. 55 (1H, s).

25 実施例 1073

2-{2-[3-第3ブチル-5-(4-ヒドロキシ-4-メチル-ピペリジン-1-イル)-4-メトキ

シーフェニル]-2-オキソ-エチル}-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド；臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1.18 (3H, s), 1.35 (9H, s), 1.57-1.76 (4H, m), 2.77 (3H, d, J=4.4Hz), 2.91 (6H, s), 2.94
 5 -3.07 (4H, m), 3.93 (3H, s), 4.30 (1H, s), 4.73 (2H, s), 5.44 (2H, s), 7.15 (1H, s), 7.54 (1H, s), 7.56 (1H, s), 8.06 (1H, s), 8.28-8.42 (1H, m), 8.80-8.98 (1H, m), 9.38-9.60 (1H, m).

実施例 1074

6-{2-[3-第3ブチル-5-(4-ヒドロキシ-4-メチル-ピペリジン-1-イル)-4-メトキ

シーフェニル]-2-オキソ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ

[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド；トリフルオロ酢酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1.18 (3H, s), 1.30-1.44 (12H, m), 1.58-1.76 (4H, m), 2.77 (3H, d, J=4.8Hz), 2.91-3.08
 (4H, m), 3.93 (3H, s), 4.13-4.40 (3H, m), 4.87 (2H, s), 5.52 (2H, s), 7.54 (1H, s), 7.56 (1H, s), 7.99 (1H, s), 8.42-8.60 (1H, m), 9.31-9.44 (1H, m), 9.88-10.02 (1H, m).

実施例 1075

メタンスルфон酸 2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-モルフォリノ-フェニルエステル；臭化水素酸塩

20 1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1.29 (3H, t, J=7.0Hz), 1.40 (3H, t, J=7.0Hz), 1.45 (9H, s), 2.95 (4H, brs), 3.79 (4H, brs), 3.84 (3H, s), 4.121 (2H, q, J=7.0Hz), 4.21 (2H, q, J=7.0Hz), 4.80 (2H, s), 5.51 (2H, s), 7.34 (1H, s), 7.72 (1H, d, J=2.0Hz), 7.83 (1H, d, J=2.0Hz).

MS:m/e (ESI) 592.3 (MH+)

25 実施例 1076

メタンスルfon酸 2-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバ

モイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-モルフォリノ-フェニル エステル;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

]1. 42 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 45 (9H, s), 2. 82 (3H, d, J=4. 6Hz), 2. 95 (4H, brs), 3. 78 (4H, b
5 rs), 3. 85 (3H, s), 4. 28 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 86 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 7. 55 (1H, s), 7. 73 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 84 (1H, d, J=2. 0Hz), 8. 21 (1H, q, J=4. 6Hz), 8. 56 (1H, s):

MS:m/e (ESI) 587. 3 (MH+)

実施例 1077

1-[3-第3ブチル-5-(4-メタシスルフォニル-ピペラジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 29 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 39 (3H, t, J=7. 0Hz), 2. 95 (3H, s), 3. 09 (4H, brs),
10 , 3. 28 (4H, brs), 3. 95 (3H, s), 4. 11 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 21 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 78 (2H, b
rs), 5. 45 (2H, brs), 7. 32 (1H, s), 7. 53 (1H, s), 7. 62 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 605. 3 (MH+)

実施例 1078

2-[2-(3-第3ブチル-4-メトキシ-5-モルフォリノ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 37 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=7. 0Hz), 2. 82 (3H, d, J=4. 0Hz), 2. 95 (3H, s), 3. 09 (4H, brs),
15 , 3. 18 (4H, brs), 3. 95 (3H, s), 4. 27 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 83 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 53 (1H, s), 7. 63 (1H, s), 8. 20 (1H, q, J=4. 0Hz), 8. 54 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 600. 3 (MH+)

実施例 1079

6-エトキ-3-イミノ-2-[2-(3-イソプロピル-4-メトキシ-5-モルフォリノ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

5 1. 20 (6H, d, J=7. 2Hz), 1. 41 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 81 (3, d, J=4. 0Hz), 2. 94-3. 08 (4H, m),
3. 68-3. 88 (4H, m), 3. 87 (3H, s), 4. 28 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 85 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 39
(1H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 59 (1H, s), 8. 20 (1H, q, J=4. 0Hz), 8. 56 (1H, s).

実施例 1080

6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2-[2-(3-イソプロピル-4-メトキシ-5-モルフォリノ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 20 (6H, d, J=6. 4Hz), 2. 77 (3H, d, J=4. 4Hz), 2. 91 (6H, s), 2. 90-3. 10 (5H, m), 3. 68-3.
92 (4H, m), 3. 87 (3H, s), 4. 74 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 7. 15 (2H, s), 7. 39 (1H, s), 7. 58 (1H,
s), 8. 07 (1H, s), 8. 37 (1H, q, J=4. 4Hz), 8. 95 (1H, brs), 9. 54 (1H, brs).

実施例 1081

6-{2-[3-第3ブチル-5-((3R, 4R)-3, 4-ジヒドロ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6, 7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド; トリフルオロ酢酸塩

20 1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 36 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 37 (9H, s), 2. 77 (3H, d, J=4. 8Hz), 2. 87-2. 98 (2H, m), 3. 50-3.
59 (2H, m), 3. 61 (3H, s), 4. 33-4. 43 (2H, m), 4. 24 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 87 (2H, s), 5. 40-5.
62 (2H, m), 7. 29 (1H, s), 7. 38 (1H, s), 7. 99 (1H, s), 8. 45-8. 62 (1H, m), 9. 37 (1H, brs), 9. 94
(1H, brs).

25 実施例 1082

2, 2-ジメチルプロピオン酸 2-第3ブチル-4-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-

イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-エトキシフェノキシメチル エステル;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 14 (9H, S), 1. 29 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 36 (9H, S), 1. 38-1. 42 (6H, m), 4. 08-4. 24 (6H, m)

5 , 4. 79 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 5. 88 (2H, s), 7. 33 (1H, s), 7. 52 (1H, s), 7. 54 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 587. 4 (MH+)

実施例 1083

2,2-ジメチルプロピオン酸 2-第3ブチル-6-エトキシ-4-[2-(5-エトキシ-1-イミ

ノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フ

10 エノキシメチル エステル;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 15 (9H, S), 1. 36 (9H, S), 1. 39-1. 43 (6H, m), 2. 82 (3H, d, J=4. 4Hz), 4. 14 (2H, q, J=7. 0

Hz), 4. 28 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 83 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 5. 88 (2H, s), 7. 53 (1H, s), 7. 54 (

1H, s), 7. 55 (1H, s), 8. 20 (1H, q, J=4. 4Hz), 8. 54 (1H, s).

15 MS:m/e (ESI) 582. 4 (MH+)

実施例 1084

(4-{3-第3ブチル-5-[2-5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イ

ソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル}-ピペラジン-1-イル)-

アセトニトリル;臭化水素酸塩

20 1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 29 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7. 0Hz), 2. 71 (4H, brs), 3. 06 (4H, br

s), 3. 83 (2H, s), 3. 94 (3H, s), 4. 11 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 21 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 79 (2H, s

), 5. 48 (2H, s), 7. 34 (1H, s), 7. 50 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 59 (1H, d, J=2. 0Hz), 9. 05 (1Hbrs

), 9. 27 (1H, brs).

25 MS:m/e (ESI) 566. 3 (MH+)

実施例 1085

2-[2-[3-第3ブチル-5-(4-シアノメチルピペラジン-1-イル)-4-メトキシフェニル]-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド；2塩酸塩

1H-NMR (DMSO-d₆) δ :

5 1.37 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=7.0Hz), 2.71 (4H, brs), 2.82 (3H, d, J=4.8Hz), 3.05 (4H, brs), 3.82 (2H, s), 3.94 (3H, s), 4.27 (2H, q, J=7.0Hz), 4.82 (2H, s), 5.46 (2H, s), 7.51 (1H, s), 7.53 (1H, s), 7.60 (1H, s), 8.20 (1H, q, J=4.8Hz), 8.54 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 561.4 (MH⁺)

実施例 1086

10 {3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニルアミノ}-酢酸；塩酸塩

1H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1.29 (3H, t, J=7.0Hz), 1.38 (9H, s), 1.40 (3H, t, J=7.0Hz), 3.76 (3H, s), 3.92 (2H, s), 4.11 (2H, q, J=7.0Hz), 4.21 (2H, q, J=7.0Hz), 4.78 (2H, s), 5.43 (2H, s), 6.99 (1H, s), 7.25 (1H, s), 7.33 (1H, s), 9.01 (1Hbrs), 9.30 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 516.3 (MH⁺)

実施例 1087

20 2-(2-{3-第3ブチル-5-[(2-ヒドロキシエチル)-メチルアミノ]-4-メトキシフェニル}-2-オキソ-エチル)-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド；2塩酸塩

1H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.36 (9H, s), 2.75 (3H, d, J=4.0Hz), 2.81 (3H, s), 2.91 (6H, s), 3.17 (2H, t, J=5.6Hz), 3.52 (2H, t, J=5.4Hz), 4.73 (2H, s), 5.52 (2H, s), 7.15 (1H, s), 7.53 (1H, s), 8.10 (1H, s), 8.38 (1H, q, J=4.0Hz), 9.17 (1H, brs), 9.65 (1H, brs).

25 実施例 1088

2-(2-{3-第3ブチル-5-[(3-ヒドロキシプロピル)-メチルアミノ]-4-メトキシフェ

エニル}-2-オキソ-エチル)-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;2 塩酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 35 (9H, s), 1. 39 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 60 (2H, t, J=6. 4Hz), 2. 73 (3H, s), 2. 81 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 13 (2H, t, J=6. 4Hz), 3. 37 (2H, t, J=6. 4Hz), 3. 81 (3H, s), 4. 26 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 83 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 50 (2H, s), 7. 53 (1H, s), 8. 22 (1H, q, J=4. 8Hz), 8. 52 (1H, s), 9. 25 (1H, brs), 9. 89 (1H, brs).

実施例 1089

1-{3-第3ブチル-5-[(3ヒドロキシプロピル)-メチルアミノ]-4-メトキシフェニル}-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-2-イル)-エタノン; 2 塩酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 28 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 36 (9H, s), 1. 39 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 61 (2H, t, J=6. 4Hz), 2. 75 (3H, s), 3. 14 (2H, t, J=6. 4Hz), 3. 38 (2H, t, J=6. 4Hz), 3. 82 (3H, s), 4. 11 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 20 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 79 (2H, s), 5. 55 (2H, s), 7. 33 (1H, s), 7. 51 (1H, s), 7. 54 (1H, s), 9. 08 (1H, brs), 9. 45 (1H, brs).

実施例 1090

2-{2-[3-第3ブチル-5-(3-ヒドロキシプロピルアミノ)-4-メトキシフェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド; 2 塩酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 36 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 77 (2H, t, J=6. 0Hz), 2. 81 (3H, d, J=4. 4Hz), 3. 19 (2H, t, J=6. 4Hz), 3. 40-3. 66 (2H, m), 3. 73 (3H, s), 4. 26 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 83 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 7. 13 (1H, s), 7. 23 (1H, s), 7. 52 (1H, s), 8. 20 (1H, q, J=4. 4Hz), 8. 56 (1H, s), 9. 36 (1H, brs), 9. 91 (1H, brs).

実施例 1091

1-[3-第3ブチル-5-(3-ヒドロキシプロピルアミノ)-4-メトキシフェニル]-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-2-イル)-エタノン;2塩酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

5 1. 29 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 36 (9H, s), 1. 39 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 77 (2H, t, J=6. 4Hz), 3. 07
-3. 24 (2H, m), 3. 45-3. 60 (2H, m), 3. 73 (3H, s), 4. 11 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 22 (2H, q, J=6.
8Hz), 4. 60 (1H, t, J=4. 0Hz), 4. 78 (2H, s), 5. 37 (1H, t, J=4. 0Hz), 5. 47 (2H, s), 7. 10 (1H
, s), 7. 22 (1H, s), 7. 33 (1H, s), 9. 03 (1H, brs), 9. 32 (1H, brs).

実施例 1092

10 2-{2-[3-第3ブチル-1-5-(2-メタンスルフォニルアミノ-エチルアミノ)-4-メトキシフェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソイ
ンドール-5-カルボン酸メチルアミド;塩酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

15 1. 35-1. 42 (12H, m), 2. 81 (3H, d, J=5Hz), 2. 91 (3H, s), 3. 15-3. 30 (4H, m), 3. 73 (3H, s),
4. 27 (2H, q, J=7Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 7. 18 (1H, brs), 7. 26 (1H, brs), 7. 53 (1H
, s), 8. 20 (1H, q, J=5Hz), 8. 56 (1H, s), 9. 36 (1H, brs), 9. 91 (1H, brs).

実施例 1093

20 N-(2-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニルアミノ}-エチル)-
メタンスルフォンアミド;塩酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

25 1. 29 (3H, t, J=7Hz), 1. 35-1. 42 (12H, m), 2. 91 (3H, s), 3. 15-3. 30 (4H, m), 3. 73 (3H, s),
4. 11 (2H, q, J=7Hz), 4. 21 (2H, q, J=7Hz), 4. 79 (2H, s),
5. 50 (2H, s), 7. 17 (1H, brs), 7. 25 (1H, brs), 7. 27-7. 35 (2H, m), 9. 07 (1H, brs), 9. 41 (1
H, brs).

実施例 1094

{3-第3ブチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-1-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニルアミノ}-酢酸;2

塩酸塩

1H-NMR(DMSO-d6) δ :

5 1.38(9H, s), 1.41(3H, t, J=7.0Hz), 2.83(3H, d, J=4.6Hz), 3.76(3H, s), 3.93(2H, s), 4.28(2H, q, J=7.0Hz), 4.83(2H, s), 5.45(2H, s), 7.00(1H, d, J=2.0Hz), 7.27(1H, d, J=2.0Hz), 7.53(1H, s), 8.21(1H, q, J=4.6Hz), 8.55(1H, s), 9.21(1H, brd, J=5.2Hz), 9.83(1H, brd, J=6.4Hz).

MS:m/e(ESI) 511.3(MH+)

10 実施例 1095

2-{2-[3-第3ブチル-4-メトキシ-5-(2-メトキシエチルアミノ)-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

1H-NMR(DMSO-d6) δ :

15 1.36(9H, s), 1.41(3H, t, J=7.2Hz), 2.82(3H, d, J=4.0Hz), 3.20-3.50(2H, m), 3.28(3H, s), 3.55(2H, t, J=6.0Hz), 3.72(3H, s), 4.27(2H, q, J=7.2Hz), 4.84(2H, s), 5.22(1H, t, J=6.0Hz), 5.47(2H, s), 7.17(1H, s), 7.25(1H, s), 7.54(1H, s), 8.20(1H, q, J=4.0Hz), 8.55(1H, s), 9.18(1H, brs), 9.82(1H, brs).

MS:m/e(ESI) 511.3(MH+)

20 実施例 1096

1-[3-第3ブチル-4-メトキシ-5-(2-メトキシエチルアミノ)-フェニル]-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

1H-NMR(DMSO-d6) δ :

25 1.29(3H, t, J=7.2Hz), 1.36(9H, s), 1.40(3H, t, J=7.2Hz), 3.25-3.41(2H, m), 3.54(2H, d, J=5.6Hz), 3.72(3H, s), 4.10(2H, q, J=7.2Hz), 4.20(2H, q, J=7.2Hz), 4.79(2H, s),

5.22(1H, t, J=4.0Hz), 5.46(s, 2H), 7.15(1H, s), 7.24(1H, s), 7.33(s, 1H).

MS:m/e(ESI) 516.3(MH+)

実施例 1097

2-(2-[3-第3ブチル-5-[(2-ヒドロキシエチル)-(2-メトキシエチル)-アミノ]-4-
メトキシフェニル]-2-オキソ-エチル)-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-
イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;2塩酸塩

1H-NMR(DMSO-d6) δ:

1.36(9H, s), 1.41(3H, t, J=7.2Hz), 2.81(3H, d, J=4.4Hz), 3.15(3H, s), 3.28(2H, t, J=6.0Hz), 3.26-3.64(6H, m), 3.82(3H, s), 4.27(3H, q, J=7.2Hz), 4.84(2H, s), 5.54(2H, s), 7.51(1H, s), 7.52(1H, s), 7.60(1H, s), 8.21(1H, q, J=4.4Hz), 8.56(1H, s), 9.36(1H, s), 9.92(1H, s).

実施例 1098

1-[3-第3ブチル-5-[(2-ヒドロキシエチル)-(2-メトキシエチル)-アミノ]-4メト-
キシフェニル]-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソイ-
ンドール-2-イル)-エタノン;2塩酸塩

1H-NMR(DMSO-d6) δ:

1.29(3H, t, J=7.2Hz), 1.36(9H, s), 1.39(3H, t, J=7.2Hz), 3.15(3H, s), 3.28(2H, t, J=6.0Hz), 3.20-3.78(4H, m), 3.46(2H, t, J=6.0Hz), 3.82(3H, s), 4.12(2H, q, J=7.2Hz), 4.21(2H, q, J=7.2Hz), 4.79(2H, s), 5.51(2H, s), 7.33(1H, s), 7.51(1H, s), 7.58(1H, s), 9.06(1H, brs), 9.39(1H, brs).

実施例 1099

1-[3-第3ブチル-4-メトキシ-5-(2-モルフォリノ-2-オキソ-エトキシ)-フェニ-
ル]-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-
イル)-エタノン;臭化水素酸塩

1H-NMR(DMSO-d6) δ:

1.29(3H, t, J=7.0Hz), 1.38(9H, s), 1.40(3H, t, J=7.0Hz), 3.44-3.62(8H, m), 3.97(3H

, s), 4.11 (2H, q, J=7.0Hz), 4.21 (2H, q, J=7.0Hz), 4.78 (2H, s), 5.02 (2H, s), 5.45 (2H, s), 7.33 (1H, s), 7.44 (1H, d, J=2.0Hz), 7.53 (1H, d, J=2.0Hz).

MS:m/e (ESI) 586.3 (MH⁺)

実施例 1100

5 2-[2-[3-第3ブチル-4-メトキシ-5-(2-モルフォリノ-2-オキソ-エトキシ)-フェニル]-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

10 1.38 (9H, s), 1.42 (3H, t, J=7.0Hz), 2.82 (3H, d, J=4.6Hz), 3.44-3.62 (8H, m), 3.97 (3H, s), 4.28 (2H, q, J=7.0Hz), 4.84 (2H, s), 5.02 (2H, s), 5.47 (2H, s), 7.45 (1H, s), 7.54 (2H, s), 8.20 (1H, q, J=4.6Hz), 8.55 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 581.3 (MH⁺)

実施例 1101

15 1-[3-第3ブチル-5-((3R,4R)-3-ヒドロキシ-4-メトキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;トリフルオロ酢酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

20 1.29 (3H, t, J=7.2Hz), 1.37 (9H, s), 1.39 (3H, t, J=7.2Hz), 2.91-2.99 (1H, m), 3.03-3.12 (1H, m), 3.30 (3H, s), 3.40-3.58 (2H, m), 3.63 (3H, s), 3.71-3.79 (1H, m), 4.10 (2H, q, J=7.2Hz), 4.10-4.30 (3H, m), 4.78 (2H, s), 5.25 (1H, brs), 5.38-5.60 (2H, m), 7.30 (1H, s), 7.33 (1H, s), 7.41 (1H, s), 8.99-9.12 (1H, m), 9.20-9.40 (1H, m).

MS:m/e (ESI) 558.3 (MH⁺)

実施例 1102

25 2-[2-(3-第3ブチル-5-シクロプロピルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d₆) δ :

0.48-0.58(2H, m), 0.72(2H, m), 1.37(9H, s), 1.41(3H, t, J=7.2Hz), 2.34-2.38(1H, m), 2.82(3H, d, J=4.4Hz), 3.66(3H, s), 4.28(2H, q, J=7.2Hz), 4.85(2H, s), 5.48(2H, s), 5.83(1H, s), 7.28(1H, d, J=2.0Hz), 7.47(1H, d, J=2.0Hz), 7.54(1H, s), 8.20(1H, d, J=4.4Hz), 8.55(1H, s), 9.18(1H, brs), 9.83(1H, brs).

5

MS:m/e (ESI) 493.3 (MH⁺)

実施例 1103

1-(3-第3ブチル-5-シクロプロピルアミノ-4-メトキシフェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-2-イル)-エタノン;

10

臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d₆) δ :

0.47-0.54(2H, m), 0.72-0.80(2H, m), 1.29(3H, t, J=7.2Hz), 1.36(9H, s), 1.40(3H, t, J=7.2Hz), 2.32-2.38(1H, m), 3.66(3H, s), 4.11(2H, q, J=7.2Hz), 4.21(2H, q, J=7.2Hz), 4.79(2H, s), 5.46(2H, s), 5.82(1H, s), 7.27(1H, s), 7.33(1H, s), 7.46(1H, s).

15

MS:m/e (ESI) 498.3 (MH⁺)

実施例 1104

2-[2-(3-第3ブチル-5-シクロヘンチルアミノ-4-メトキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

20

1H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.36(9H, s), 1.42(3H, t, J=7.2Hz), 1.40-1.65(6H, m), 1.86-2.02(2H, m), 2.82(3H, d, J=4.8Hz), 3.71(3H, s), 3.62-3.82(1H, s), 4.27(2H, q, J=7.2Hz), 4.84(2H, s), 5.05(1H, d, J=6.4Hz), 5.47(2H, s), 7.14(1H, d, J=2.0Hz), 7.23(1H, d, J=2.0Hz), 7.54(1H, s), 8.21(1H, d, J=4.8Hz), 8.55(1H, s), 9.17(1H, brs), 9.82(1H, brs).

25

MS:m/e (ESI) 521.3 (MH⁺)

実施例 1105

1-(3-第3ブチル-5-シクロペンチルアミノ-4-メトキシフェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

5 1.29 (3H, t, J=7.2Hz), 1.36 (9H, s), 1.40 (3H, t, J=7.2Hz), 1.48-1.76 (6H, m), 1.90-2.02 (2H, m), 3.71 (3H, s), 3.72-3.84 (1H, m), 4.11 (2H, q, J=7.2Hz), 4.21 (2H, q, J=7.2Hz), 4.78 (2H, s), 5.04 (1H, d, J=6.4Hz), 5.45 (2H, s), 7.13 (1H, d, J=2.0Hz), 7.22 (1H, J=2.0Hz), 7.32 (1H, s).

実施例 1106

10 1-(3-アミノ-5-第3ブチル-4-メトキシフェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

15 1.38 (3H, t, J=7.2Hz), 1.43 (9H, s), 1.50 (3H, t, J=7.2Hz), 3.85 (3H, s), 4.17 (2H, q, J=7.2Hz), 4.24 (2H, q, J=7.2Hz), 4.82 (2H, s), 5.39 (2H, s), 7.19 (1H, s), 7.44 (1H, d, J=2.0Hz), 7.48 (1H, d, J=2.0Hz).

MS:m/e (ESI) 458.2 (MH+)

実施例 1107

1-(3-第3ブチル-4-メトキシ-5-ニトロフェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

20 1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1.29 (3H, t, J=7.6Hz), 1.40 (12H, s) and
t, J=7.6Hz), 3.84 (3H, s), 4.11 (2H, q, J=7.6Hz), 4.21 (2H, q, J=7.6Hz), 4.81 (2H, s), 5.49 (2H, s), 7.32 (1H, s), 8.07 (1H, d, J=2.0Hz), 8.39 (1H, d, J=2.0Hz).

MS:m/e (ESI) 488.2 (MH+)

25 実施例 1108

2-[2-(3-第3ブチル-5-イソプロピルアミノ-4-メトキシフェニル)-2-オキソエ

チル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 19 (6H, d, J=6. 0Hz), 1. 36 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 82 (3H, d, J=4. 4Hz), 3. 60
 5 -3. 78 (1H, m), 3. 71 (3H, s), 4. 28 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 83 (2H, s), 4. 90 (1H, d, J=6. 0Hz),
 5. 46 (2H, s), 7. 14 (1H, s), 7. 22 (1H, s), 7. 53 (1H, s), 8. 20 (1H, d, J=4. 4Hz), 8. 55 (1H, s)
).

実施例 1109

1-(3-第3ブチル-5-イソプロピルアミノ-4-メトキシフェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 19 (6H, d, J=6. 4Hz), 1. 29 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 36 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7. 2Hz), 3. 60
 -3. 76 (1H, m), 3. 71 (3H, s), 4. 11 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 21 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 78 (2H, s),
 15 4. 89 (1H, d, J=8. 4Hz), 5. 45 (2H, s), 7. 13 (1H, s), 7. 20 (1H, s), 7. 33 (1H, s).

実施例 1110

2-[2-(3-第3ブチル-5-シクロブチルアミノ-4-メトキシフェニル)-2-オキソエチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

20 1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 36 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 64-1. 80 (2H, m), 1. 87-2. 02 (2H, m), 2. 28-2. 40 (2H, m), 2. 82 (3H, d, J=6. 4Hz), 3. 73 (3H, s), 3. 84-3. 98 (1H, m), 4. 28 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 46 (2H, s), 5. 50 (1H, d, J=6. 0Hz), 7. 03 (1H, s), 7. 24 (1H, s), 7. 54 (1H, s), 8. 20 (1H, d, J=6. 4Hz), 8. 55 (1H, s), 9. 16 (1H, brs), 9. 81 (1H, brs).

25 実施例 1111

1-(3-第3ブチル-5-シクロブチルアミノ-4-メトキシフェニル)-2-(5,6-ジエト

キシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 29 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 36 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 60-1. 78 (2H, m), 1. 86-2.
 5 02 (2H, m), 2. 37-2. 40 (2H, m), 3. 73 (3H, s), 3. 86-3. 97 (1H, m), 4. 11 (2H, q, J=7. 2Hz), 4
 . 21 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 78 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 5. 49 (1H, s, J=6. 0Hz), 7. 02 (1H, s), 7.
 23 (1H, s), 7. 33 (1H, s).

実施例 1112

1-[3-(4-アセチル-ピペラジン-1-イル)-5-第3ブチル-4-メトキシ-フェニル]-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 29 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7. 0Hz), 2. 04 (3H, s), 2. 93 (2H, brs)
 15 , 2. 99 (2H, brs), 3. 65 (4H, brs), 3. 96 (3H, s), 4. 11 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 21 (2H, q, J=7. 0
 Hz), 4. 79 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 34 (1H, s), 7. 49 (1H, sz), 7. 61 (1H, s), 9. 05 (1Hbrs),
 9. 27 (1H, brs).

MS:m/e(ESI) 569. 4 (MH+)

実施例 1113

イソプロピルカルバミン酸 2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-エトキシ-フェニルエステル;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 13 (6H, d, J=6. 4Hz), 1. 27-1. 34 (15H, m), 1. 40 (3H, t, J=7. 0Hz), 3. 61-3. 70 (1H, m), 4
 . 07 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 12 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 21 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 81 (2H, s), 5. 50 (2H, s),
 25 7. 34 (1H, s), 7. 50 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 55 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 78 (1H, d, J=8. 0Hz),
 9. 07 (1H, brd, J=6. 8Hz), 9. 33 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 558. 3 (MH⁺)

実施例 1114

2-[2-[3-(4-アセチル-ピペラジン-1-イル)-5-第3ブチル-1-メトキシフェニル]-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

5

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 38 (9H, s), 1. 42 (3H, t, J=7. 0Hz), 2. 04 (3H, s), 2. 83 (3H, d, J=4. 8Hz), 2. 93 (2H, brs), 3. 00 (2H, brs), 3. 65 (4H, brs), 3. 97 (3H, s), 4. 28 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 51 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 54 (1H, s), 7. 62 (1H, d, J=2. 0Hz), 8. 21 (1H, q, J=4. 8Hz), 8. 56 (1H, s).

10

MS: m/e (ESI) 564. 3 (MH⁺)

実施例 1115

イソプロピルカルバミン酸 2-第3ブチル-6-エトキシ-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニルエステル;臭化水素酸塩

15

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 13 (6H, d, J=6. 4Hz), 1. 31 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 34 (9H, s), 1. 42 (3H, t, J=7. 0Hz), 2. 83 (3H, d, J=4. 6Hz), 3. 61-3. 68 (1H, m), 4. 07 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 28 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 86 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 51 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 55 (1H, s), 7. 57 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 78 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 21 (1H, q, J=4. 6Hz), 8. 56 (1H, s), 9. 21 (1H, brs), 9. 86 (1H, brs).

20

MS: m/e (ESI) 553. 3 (MH⁺)

実施例 1116

1-[3-第3ブチル-5-((3S, 4S)-3-ヒドロキシ-4-メトキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシフェニル]-2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;トリフルオロ酢酸塩

25

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 29 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 39 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 91-2. 99 (1H, m), 3. 03-3. 12 (1H, m), 3. 30 (3H, s), 3. 40-3. 58 (2H, m), 3. 63 (3H, s), 3. 71-3. 79 (1H, m), 4. 10 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 10-4. 30 (3H, m), 4. 78 (2H, s), 5. 38-5. 60 (2H, m), 7. 30 (1H, s), 7. 33 (1H, s), 7. 41 (1H, s), 8. 99-9. 12 (1H, m), 9. 20-9. 40 (1H, m).

5 MS:m/e (ESI) 558. 3 (MH⁺)

実施例 1117

ジメチルカルバミン酸 2-第3ブチル-4-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-エトキシフェニルエステル; 臭化水素酸塩

10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (6H, t, J=7. 0Hz), 1. 34 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7. 0Hz), 2. 92 (3H, s), 3. 09 (3H, s), 4. 08-4. 24 (6H, m), 4. 80 (2H, s), 5. 50 (2H, s), 7. 34 (1H, s), 7. 51 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 56 (1H, d, J=2. 0Hz), 9. 02 (1H, brs), 9. 33 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 544. 3 (MH⁺)

実施例 1118

1-[3-第3ブチル-4-メトキシ-5-(2-モルフォリノ-2-オキソ-エチルアミノ)-フェニル]-2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

11 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 29 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 38 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7. 0Hz), 3. 47-3. 63 (8H, m), 3. 77 (3H, s), 4. 02 (2H, s), 4. 11 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 21 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 79 (2H, s), 5. 44 (2H, s), 7. 13 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 27 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 34 (1H, s), 9. 13 (1H, brs), 9. 31 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 585. 3 (MH⁺)

実施例 1119

ジメチルカルバミン酸 2-第3ブチル-6-エトキシ-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ

-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニルエステル;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 29 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 34 (9H, s), 1. 42 (3H, t, J=7. 0Hz), 2. 83 (3H, d, J=5. 0Hz), 2. 93 (3H, s), 3. 10 (3H, s), 3. 94-4. 02 (1H, m), 4. 12-4. 20 (1H, m), 4. 28 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 86 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 7. 52 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 55 (1H, s), 7. 58 (1H, d, J=2. 0Hz), 8. 21 (1H, q, J=5. 0Hz), 8. 56 (1H, s), 9. 22 (1H, brs), 9. 86 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 539. 3 (MH+)

実施例 1120

2-[2-[3-第3ブチル-4-メトキシ-5-(2-メトキシ-1-メチル-エチルアミノ)-フェニル]-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 17 (3H, d, J=6. 4Hz), 1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 82 (3H, d, J=4. 2Hz), 3. 27 (3H, s), 3. 37-3. 48 (2H, m), 3. 71 (3H, s), 3. 71-3. 85 (1H, m), 4. 27 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 84 (2H, s), 4. 90 (1H, d, J=6. 0Hz), 5. 46 (2H, s), 7. 18 (1H, s), 7. 23 (1H, s), 7. 53 (1H, s), 8. 20 (1H, s, J=4. 2Hz), 8. 55 (1H, s), 9. 16 (1H, brs), 9. 81 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 525. 3 (MH+)

実施例 1121

1-[3-第3ブチル-4-メトキシ-5-(2-メトキシ-1-メチル-エチルアミノ)-フェニル]-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 17 (3H, d, J=6. 4Hz), 1. 29 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 36 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7. 2Hz), 3. 28 (3H, s), 3. 37-3. 48 (2H, m), 3. 71 (3H, s), 3. 62-3. 79 (1H, m), 4. 11 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 21 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 79 (2H, s), 4. 90 (1H, d, J=6. 0Hz), 5. 46 (2H, s), 7. 17 (1H, d, J=2. 0

Hz), 7.22(1H, d, J=2.0Hz), 7.33(1H, s), 9.03(1H, brs), 9.28(1H, brs).

実施例 1122

2-[2-[3-第3ブチル-4-メトキシ-5-(テトラヒドロピラン-4-イルアミノ)-フェニル]-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

1H-NMR(DMSO-d6) δ :

1.37(9H, s), 1.41(3H, t, J=7.2Hz), 1.57-1.72(2H, m), 2.08-2.21(2H, m), 2.55-2.90(5H, m), 3.72(3H, s), 4.29(2H, q, J=7.2Hz), 4.84(2H, s), 5.11(1H, d, J=6.0Hz), 5.46(2H, s), 7.14(1H, d, J=2.0Hz), 7.22(1H, d, J=2.0Hz), 7.53(1H, s), 8.20(1H, q, J=4.2Hz), 8.55(1H, s), 9.16(1H, s), 9.82(1H, s).

MS:m/e(ESI) 553.3(MH⁺)

実施例 1123

1-[3-第3ブチル-4-メトキシ-5-(テトラヒドロピラン-4-イルアミノ)-フェニル]-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

1H-NMR(DMSO-d6) δ :

1.29(3H, t, J=7.2Hz), 1.36(9H, s), 1.40(3H, t, J=7.2Hz), 1.58-1.77(2H, m), 2.08-2.20(2H, m), 2.50-2.81(5H, m), 3.72(s, 3H), 4.11(2H, q, J=7.2Hz), 4.21(2H, q, J=7.2Hz), 4.78(2H, s), 5.10(1H, d, J=6.0Hz), 5.43(2H, s), 7.13(1H, s), 7.21(1H, s), 7.33(1H, s).

MS:m/e(ESI) 558.3(MH⁺)

実施例 1124

1-(3-第3ブチル-5-イソブチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

1H-NMR(DMSO-d6) δ :

0.94(6H, d, J=6.8Hz), 1.29(3H, t, J=7.0Hz), 1.37(9H, s), 1.40(3H, t, J=7.0Hz), 1.93
-2.00(1H, m), 2.90-2.93(2H, m), 3.75(3H, s), 4.11(2H, q, J=7.0Hz), 4.21(2H, q, J=7.
0Hz), 4.79(2H, s), 5.38(1H, brs), 5.48(2H, s), 7.06(1H, s), 7.20(1H, s), 7.33(1H, s)
, 9.05(1H, brs), 9.29(1H, brs).

5 MS:m/e(ESI) 514.3(MH+)

実施例 1125

2-[2-(3-第3ブチル-5-イソブチルアミノ-4-メトキシフェニル)-2-オキソエチ
ル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチ
ルアミド;臭化水素酸塩

10 1H-NMR(DMSO-d6) δ:

0.94(6H, d, J=6.8Hz), 1.37(9H, s), 1.42(3H, t, J=7.0Hz), 1.93-2.00(1H, m), 2.82(3H
,d, J=4.8Hz), 2.91-2.93(2H, m), 3.75(3H, s), 4.28(2H, q, J=7.0Hz), 4.84(2H, s), 5.3
8(1H, t, J=6.0Hz), 5.46(2H, s), 7.07(1H, d, J=2.0Hz), 7.22(1H, d, J=2.0Hz), 7.54(1H
,s), 8.21(1H, q, J=4.8Hz), 8.56(1H, s), 9.15(1H, d, J=5.8Hz), 9.82(1H, d, J=5.8Hz).

15 MS:m/e(ESI) 509.3(MH+)

実施例 1126

2-[2-(3-第3ブチル-5-イソブチルアミノ-4-メトキシフェニル)-2-オキソエチ
ル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン
酸メチルアミド;臭化水素酸塩

20 1H-NMR(DMSO-d6) δ:

0.94(6H, d, J=6.8Hz), 1.37(9H, s), 1.93-2.00(1H, m), 2.78(3H, d, J=4.6Hz), 2.92(8H
, brs), 3.75(3H, s), 4.73(2H, s), 5.37(1H, t, J=5.6Hz), 5.42(2H, s), 7.07(1H, s), 7.1
5(1H, s), 7.21(1H, s), 8.07(1H, s), 8.37(1H, q, J=4.6Hz), 8.91(1H, brs), 9.51(1H, br
s).

25 MS:m/e(ESI) 508.3(MH+)

実施例 1127

1-[3-第3ブチル-5-((3S,4S)-3,4-ジメトキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

1H-NMR(DMSO-d6) δ :

5 1.28(3H, t, J=7.2Hz), 1.37(9H, s), 1.39(3H, t, J=7.2Hz), 3.03-3.16(2H, m), 3.29(6H, s), 3.36-3.52(2H, m), 3.64(3H, s), 3.91(2H, brs), 4.11(2H, q, J=7.2Hz), 4.21(2H, q, J=7.2Hz), 4.78(2H, s), 5.36-5.62(2H, m), 7.33(2H, s), 7.44(1H, s), 8.95-9.35(2H, m).

MS:m/e(ESI) 572.4(MH+)

10 実施例 1128

2-{2-[3-第3ブチル-5-((3S,4S)-3,4-ジメトキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

1H-NMR(DMSO-d6) δ :

15 1.37(9H, s), 1.41(3H, t, J=6.8Hz), 2.79-2.87(3H, m), 3.05-3.15(2H, m), 3.29(6H, s), 3.38-3.52(2H, m), 3.64(3H, s), 3.91(2H, brs), 4.27(2H, q, J=6.8Hz), 4.84(2H, s), 5.40-5.62(2H, m), 7.34(1H, s), 7.46(1H, s), 7.54(1H, s), 8.13-8.30(1H, m), 8.55(1H, s), 9.05-9.22(1H, m), 9.77-9.92(1H, m).

MS:m/e(ESI) 567.3(MH+)

20 実施例 1129

2-{2-[3-第3ブチル-5-(2-シアノ-エチルアミノ)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

1H-NMR(DMSO-d6) δ :

25 1.33-1.42(12H, m), 2.78-2.88(5H, m), 3.45(2H, m), 3.75(3H, s), 4.27(2H, q, J=7Hz), 4.84(2H, s), 5.47(2H, s), 5.74(1H, m), 7.16(1H, s), 7.28(1H, s), 7.53(1H, s), 8.20(1

H, q, J=5Hz), 8.55(1H, s), 9.15(1H, brs), 9.83(1H, brs).

実施例 1130

3-[3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-1-ソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニルアミノ]-プロピオニトリル;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1.29(3H, t, J=7Hz), 1.33-1.42(12H, m), 2.83(2H, t, J=6Hz), 3.45(2H, m), 3.75(3H, s), 4.11(2H, q, J=7Hz), 4.21(2H, q, J=7Hz), 4.79(2H, s), 5.47(2H, s), 5.74(1H, m), 7.15(1H, brs), 7.27(1H, brs), 7.33(1H, brs), 9.04(1H, brs), 9.29(1H, brs).

実施例 1131

2-[2-(3-第3ブチル-4-メトキシ-5-ピペラジン-1-イル-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;2塩酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1.38(9H, s), 1.42(3H, t, J=7.0Hz), 2.82(3H, d, J=4.8Hz), 3.21(4H, brs), 3.34(2H, m), 3.41-3.48(1H, m), 3.63-3.70(1H, m), 3.94(3H, s), 4.28(2H, q, J=7.0Hz), 4.84(2H, s), 5.57(2H, s), 7.51(1H, s), 7.54(1H, s), 7.65(1H, s), 8.21(1H, q, J=4.8Hz), 8.56(1H, s), 9.12(1H, brs), 9.18(1H, brs), 9.32(1H, brs), 9.90(1H, brs).

MS:m/e (ESI) 522.3 (MH⁺)

実施例 1132

1-[3-第3ブチル-5-(4-イソプロピル-ピペラジン-1-イル)-4-メトキシフェニル]-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-1-ソインドール-2-イル)-エタノン;2塩酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1.22-1.38(21H, m), 3.02-3.58(8H, m), 3.94(3H, s), 4.11(2H, q, J=7.0Hz), 4.21(2H, q, J=7.0Hz), 4.80(2H, s), 5.56(2H, s), 7.34(1H, s), 7.50(1H, s), 7.64(1H, s), 9.08(1H,

brs), 9.43(1H, brs).

MS:m/e (ESI) 569.4 (MH⁺)

実施例 1133

4-[3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソイソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル]-ピペラジン-1-カルボン酸ジメチルアミド;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1.29(3H, t, J=7.0Hz), 1.37(9H, s), 1.40(3H, t, J=7.0Hz), 2.77(6H, s), 2.99(4H, brs), 3.37(4H, brs), 3.95(3H, s), 4.11(2H, q, J=7.0Hz), 4.21(2H, q, J=7.0Hz), 4.79(2H, s), 5.48(2H, s), 7.34(1H, s), 7.52(1H, s), 7.60(1H, s), 9.05(1Hbrs), 9.27(1H, brs).

MS:m/e (ESI) 598.3 (MH⁺)

実施例 1134

2-{2-[3-第3ブチル-5-(4-ジメチルカルバモイル-ピペラジン-1-イル)-4-メトキシフェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソイソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1.37(9H, s), 1.42(3H, t, J=7.0Hz), 2.77(6H, s), 2.83(3H, d, J=5.2Hz), 3.00(4H, brs), 3.31(4H, brs), 3.95(3H, s), 4.28(2H, q, J=7.0Hz), 4.84(2H, s), 5.49(2H, s), 7.53(1H, s), 7.54(1H, s), 7.61(1H, s), 8.21(1H, q, J=5.2Hz), 8.56(1H, s).

MS:m/e (ESI) 593.4 (MH⁺)

実施例 1135

(4-[3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソイソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル]-ピペラジン-1-イル)-酢酸;2塩酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1.29(3H, t, J=7.0Hz), 1.38(9H, s), 1.40(3H, t, J=7.0Hz), 3.10-3.69(10H, m), 3.93(3

H, s), 4.12 (2H, q, J=7.0Hz), 4.21 (2H, q, J=7.0Hz), 4.22 (2H, brs), 4.80 (2H, s), 5.54 (2H, s), 7.34 (1H, s), 7.49 (1H, s), 7.64 (1H, s), 9.10 (1H, brs), 9.40 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 585.3 (MH⁺)

実施例 1136

5 2-[2-[3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-(2-モルフォリノ-エチルアミノ)-フェニル]-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

10 1.33-1.42 (12H, m), 2.40-2.60 (4H, m), 2.80-2.86 (5H, m), 3.20-3.36 (2H, m), 3.58 (4H, m), 3.75 (3H, s), 4.28 (2H, q, J=7Hz), 4.84 (2H, s), 5.49 (2H, s), 7.15 (1H, brs), 7.25 (1H, brs), 7.54 (1H, s), 8.21 (1H, m), 8.56 (1H, s).

実施例 1137

1-[3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-(2-モルフォリノ-エチルアミノ)-フェニル]-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1.29 (3H, t, J=7Hz), 1.33-1.42 (12H, m), 2.40-2.60 (4H, m), 3.20-3.40 (4H, m), 3.58 (4H, m), 3.74 (3H, s), 4.11 (2H, q, J=7Hz), 4.21 (2H, q, J=7Hz), 4.79 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.14 (1H, brs), 7.24 (1H, brs), 7.34 (1H, brs).

20 実施例 1138

1-{3-第 3 ブチル 1-5-[4-(2-ヒドロキシ-アセチル)-ピペラジン-1-イル]-4-メトキシ-フェニル}-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソイソドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

25 1.29 (3H, t, J=7.0Hz), 1.37 (9H, s), 1.40 (3H, t, J=7.0Hz), 2.98 (4H, brs), 3.57 (2H, brs), 3.70 (2H, brs), 3.96 (3H, s), 4.11 (2H, q, J=7.0Hz), 4.12 (2H, s), 4.21 (2H, q, J=7.0

Hz), 4.79(2H, s), 5.47(2H, s), 7.34(1H, s), 7.49(1H, d, J=2.0Hz), 7.61(1H, d, J=2.0Hz), 9.05(1H, brs), 9.27(1H, brs).

MS:m/e(ESI) 585.3(MH⁺)

実施例 1139

5 2-(2-{3-第3ブチル-5-[4-(2-ヒドロキシ-アセチル)-ピペラジン-1-イル]-4-メトキシ-フェニル}-2-オキソ-エチル)-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-インンドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

1H-NMR(DMSO-d6) δ:

10 1.37(9H, s), 1.41(3H, t, J=7.0Hz), 2.82(3H, d, J=4.8Hz), 2.98(4H, brs), 3.57(2H, brs), 3.69(2H, brs), 3.97(3H, s), 4.13(2H, d, J=5.6Hz), 4.28(2H, q, J=7.0Hz), 4.66(1H, t, J=5.6Hz), 4.84(2H, s), 5.49(2H, s), 7.50(1H, d, J=2.0Hz), 7.54(1H, s), 7.62(1H, d, J=2.0Hz), 8.21(1H, q, J=4.8Hz), 8.55(1H, s).

MS:m/e(ESI) 580.3(MH⁺)

実施例 1140

15 4-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-1ソインドール-1-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピペラジン-1-カルボン酸エチルアミド;臭化水素酸塩

1H-NMR(DMSO-d6) δ:

20 1.01(3H, t, J=7.0Hz), 1.30(3H, t, J=7.0Hz), 1.37(9H, s), 1.40(3H, t, J=7.0Hz), 2.93(4H, brs), 3.02-3.08(2H, m), 3.49(4H, brs), 3.95(3H, s), 4.12(2H, q, J=7.0Hz), 4.22(2H, q, J=7.0Hz), 4.79(2H, s), 5.48(2H, s), 7.34(1H, s), 7.50(1H, s), 7.60(1H, s).

MS:m/e(ESI) 598.3(MH⁺)

実施例 1141

25 2-{2-[3-第3ブチル-5-(4-エチルカルバモイル-ピペラジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 01 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=7. 0Hz), 2. 83 (3H, d, J=4. 6Hz), 2. 93 (4H, brs), 3. 05 (2H, q, J=7. 0Hz), 3. 49 (4H, brs), 3. 95 (3H, s), 4. 28 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 6. 58 (1H, m), 7. 51 (1H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 61 (1H, s), 8. 21 (1H, q, J=4. 6Hz), 8. 56 (1H, s), 9. 16 (1H, brs), 9. 85 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 593. 4 (MH⁺)

実施例 1142

(4-[3-第3ブチル-5-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル]-ピペラジン-1-イル

1)-酢酸エチルエステル; 2 塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 25 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 29 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7. 0Hz), 3. 02 -3. 70 (10H, m), 3. 93 (3H, s), 4. 11 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 18-4. 25 (4H, m), 4. 28 (1H, brs), 4. 80 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 7. 34 (1H, s), 7. 50 (1H, s), 7. 64 (1H, s), 9. 08 (1H, brs), 9. 37 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 613. 4 (MH⁺)

実施例 1143

1-[3-第3ブチル-4-メトキシ-5-[4-(2メトキシ-アセチル)-ピペラジン-1-イル]-フェニル]-2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインド

ール-2-イル 1)-エタノン; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7. 0Hz), 2. 98 (4H, brs), 3. 29 (3H, s), 3. 61 (2H, brs), 3. 67 (2H, brs), 3. 96 (3H, s), 4. 11 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 12 (2H, s), 4. 21 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 79 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 34 (1H, s), 7. 50 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 61 (1H, d, J=2. 0Hz), 9. 03 (1H, brs), 9. 28 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 599. 4 (MH⁺)

実施例 1144

2-[2-[3-第3ブチル-5-(2-メタンスルフォニルエチルアミノ)-4-メトキシフェニル]-2-オキソエチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

5 1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1.30-1.44(12H, m), 2.82(3H, d, J=5Hz), 3.07(3H, s), 3.47(2H, m), 3.59(2H, m), 3.74(3H, s), 4.28(2H, q, J=7Hz), 4.85(2H, s), 5.49(2H, s), 7.17(1H, d, J=2Hz), 7.30(1H, d, J=2Hz), 7.53(1H, s), 8.21(1H, q, J=5Hz), 8.55(1H, s), 9.22(1H, brs), 9.86(1H, brs).

実施例 1145

10 1-[3-第3ブチル-5-(2-メタンスルフォニルエチルアミノ)-4-メトキシフェニル]-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;トリフルオロ酢酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1.29(3H, t, J=7Hz), 1.35-1.42(12H, m), 3.07(3H, s), 3.45(2H, m), 3.58(2H, m), 3.73(3H, s), 4.11(2H, q, J=7Hz), 4.21(2H, q, J=7Hz), 4.79(2H, s), 5.47(2H, s), 7.16(1H, d, J=2Hz), 7.29(1H, d, J=2Hz), 7.33(1H, brs), 9.06(1H, brs), 9.31(1H, brs).

実施例 1146

20 2-(2-[3-第3ブチル-4-メトキシ-5-[4-(2-メトキシアセチル)-ピペラジン-1-イル]-フェニル]-2-オキソエチル)-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1.37(9H, s), 1.42(3H, t, J=7.0Hz), 2.82(3H, d, J=4.4Hz), 2.99(4H, brs), 3.29(3H, s), 3.61(2H, brs), 3.67(2H, brs), 3.97(3H, s), 4.12(2H, s), 4.27(2H, q, J=7.0Hz), 4.84(2H, s), 5.49(2H, s), 7.51(1H, d, J=2.0Hz), 7.54(1H, s), 7.62(1H, d, J=2.0Hz), 8.21(1H, q, J=4.4Hz), 8.56(1H, s), 9.16(1H, brs), 9.85(1H, brs).

MS:m/e (ESI) 594.4 (MH⁺)

実施例 1147

1-(4-{3-第 3 プチル-5-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル}-ピペラジン-1-イル)-プロパン-1-オン; 臭化水素酸塩

5 1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 00 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 29 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7. 0Hz), 2. 36 (2H, q, J=7. 0Hz), 2. 94 (2H, brs), 2. 98 (2H, brs), 3. 66 (4H, brs), 3. 96 (3H, s), 4. 11 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 21 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 79 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 34 (1H, s), 7. 50 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 61 (1H, d, J=2. 0Hz), 9. 06 (1H, brs), 9. 28 (1H, brs).

10 MS:m/e (ESI) 583. 4 (MH+)

実施例 1148

2-{2-[3-第 3 プチル-4-メトキシ-5-(4-プロピオニル-ピペラジン-1-イル)-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

15 1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 00 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 38 (9H, s), 1. 42 (3H, t, J=7. 0Hz), 2. 36 (2H, q, J=7. 0Hz), 2. 83 (3H, d, J=4. 8Hz), 2. 94 (2H, brs), 2. 99 (2H, brs), 3. 66 (4H, brs), 3. 97 (3H, s), 4. 28 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 51 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 54 (1H, s), 7. 62 (1H, d, J=2. 0Hz), 8. 21 (1H, q, J=4. 8Hz), 8. 56 (1H, s), 9. 15 (1H, d, J=5. 6Hz), 9. 84 (1H, d, J=5. 6Hz).

20 MS:m/e (ESI) 578. 4 (MH+)

実施例 1149

1-[3-第 3 プチル-5-((3S, 4S)-3-エトキシ-4-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシフェニル]-2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-1ソインドール-2-イル)-エタノン; トリフルオロ酢酸塩

25 1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 10 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 29 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 39 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 90
 -3. 12 (2H, m), 3. 28-3. 58 (4H, m), 3. 63 (3H, s), 3. 80-3. 89 (1H, m), 4. 11 (2H, q, J=6. 8Hz
), 4. 12-4. 31 (3H, m), 4. 79 (2H, s), 5. 38-5. 57 (2H, m), 7. 30 (1H, s), 7. 34 (1H, s), 7. 41 (1H, s), 8. 98-9. 10 (1H, m), 9. 20-9. 35 (1H, m).

5 MS:m/e (ESI) 572. 4 (MH⁺)

実施例 1150

2-[2-[3-第 3 プチル-5-((3S, 4S)-3-エトキシ-4-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシフェニル]-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド; トリフルオロ酢酸塩

10 ¹H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 10 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 83 (3H, d, J=4. 4Hz), 2. 82
 -3. 12 (2H, m), 3. 34-3. 60 (4H, m), 3. 64 (3H, s), 3. 79-3. 92 (1H, m), 4. 10-4. 22 (1H, m), 4
 . 28 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 35-5. 60 (2H, m), 7. 32 (1H, s), 7. 42 (1H, s), 7. 54 (1H, s), 8. 14-8. 26 (1H, m), 8. 55 (1H, s), 9. 16 (1H, brs), 9. 84 (1H, brs).

15 MS:m/e (ESI) 567. 4 (MH⁺)

実施例 1151

1-[3-第 3 プチル-5-[(3-エトキシ-イソキサゾール-5-イルメチル)-アミノ]-4-メトキシフェニル]-2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-1イソインドール-2-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

20 ¹H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 24-1. 50 (6H, m), 1. 37 (9H, s), 3. 75 (3H, s), 4. 05-4. 16 (4H, m), 4. 20 (2H, q, J=7. 2Hz)
 , 4. 43 (1H, d, J=6. 0Hz), 4. 77 (2H, s), 5. 41 (2H, s), 6. 04 (1H, s), 6. 13 (1H, t, J=6. 0Hz),
 7. 11 (1H, s), 7. 26 (1H, s), 7. 32 (1H, s), 9. 01 (1H, brs), 9. 28 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 583. 3 (MH⁺)

25 実施例 1152

1-[3-第 3 プチル-4-メトキシ-5-[(3-メトキシ-イソキサゾール-5-イルメチル)-

アミノ]-フェニル}-2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-1イソインドール-2-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 29 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 37 (s, 9H), 1. 39 (3H, t, J=7. 2Hz), 3. 75 (3H, s), 3. 82 (3H, s), 4
 5 . 11 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 20 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 43 (2H, d, J=6. 0Hz), 4. 78 (2H, s), 5. 41 (2H, s), 6. 05 (1H, s), 6. 14 (1H, s, J=7. 2Hz), 7. 11 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 27 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 32 (1H, s), 9. 02 (1H, brs), 9. 29 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 569. 3 (MH+)

実施例 1153

10 2-(2-{3-第3ブチル-4-メトキシ-5-[(2-メトキシ-ピリジン-3-イルメチル)-アミノ]-フェニル}-2-オキソ-エチル)-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 37-1. 42 (12H, m), 2. 81 (3H, d, J=5Hz), 3. 82 (3H, s), 3. 92 (3H, s), 4. 26 (2H, q, J=7Hz)
 15 , 4. 30 (2H, m), 4. 79 (2H, s), 5. 37 (2H, s), 6. 09 (1H, m), 6. 89-6. 95 (2H, m), 7. 24 (1H, d, J=2Hz), 7. 50-7. 55 (2H, m), 8. 03 (1H, m), 8. 19 (1H, m), 8. 53 (1H, s), 9. 11 (1H, brs), 9. 78 (1H, brs)

実施例 1154

20 1-{3-第3ブチル-4-メトキシ-5-[(2-メトキシ-ピリジン-3-イルメチル)-アミノ]-フェニル}-2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-1イソインドール-2-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 28 (3H, t, J=7Hz), 1. 35-1. 43 (12H, m), 3. 82 (3H, s), 3. 93 (3H, s), 4. 11 (2H, q, J=7Hz),
 25 4. 20 (2H, q, J=7Hz), 4. 30 (2H, m), 4. 73 (2H, s), 5. 35 (2H, s), 6. 09 (1H, m), 6. 89-6. 95 (2H, m), 7. 22 (1H, d, J=2Hz), 7. 30 (1H, brs), 7. 52 (1H, m), 8. 03 (1H, m)

実施例 1155

1-[3-第3ブチル-5-((3R,4S)-3,4-ジヒドロキシピロリジン-1-イル)-4-メトキシフェニル]-2-(5,6-ジエチキシ-7フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-1ソインドール-1-2-イル)-エタノン；トリフルオロ酢酸塩

1H-NMR(DMSO-d6) δ :

5 1.29(3H, t, J=6.8Hz), 1.37(9H, s), 1.40(3H, t, J=6.8Hz), 3.02-3.11(2H, m), 3.30-3.54(2H, m), 3.60(3H, s), 4.00-4.16(4H, m), 4.21(2H, q, J=6.8Hz), 4.79(2H, s), 5.47(2H, s), 7.26(1H, s), 7.33(1H, s), 7.38(1H, s), 9.00-9.08(1H, m), 9.23-9.31(1H, m).

MS:m/e(ESI) 544.3(MH⁺)

実施例 1156

10 (4-{3-第3ブチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1-1,3-ジヒドロ-1ソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル}-ピペラジン-1-イル)-酢酸エチルエステ；臭化水素酸塩

1H-NMR(DMSO-d6) δ :

15 1.19(3H, t, J=7.0Hz), 1.36(9H, s), 1.41(3H, t, J=7.0Hz), 2.74(4H, brs), 2.83(3H, d, J=4.8Hz), 3.01(4H, brs), 3.30(2H, s), 3.93(3H, s), 4.09(2H, q, J=7.0Hz), 4.28(2H, q, J=7.0Hz), 4.84(2H, s), 5.49(2H, s), 7.51(1H, d, J=2.0Hz), 7.54(1H, s), 7.59(1H, d, J=2.0Hz), 8.21(1H, q, J=4.8Hz), 8.55(1H, s).

MS:m/e(ESI) 608.4(MH⁺)

実施例 1157

20 2-(2-{3-第3ブチル-4-メトキシ-5-[(2-オキソ-1,2-ジヒドロピリジン-3-イルメチル)-アミノ]-フェニル}-2-オキソ-エチル)-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-1ソインドール-5-カルボン酸 メチルアミド；トリフルオロ酢酸塩

1H-NMR(DMSO-d6) δ :

25 1.35-1.45(12H, m), 2.82(3H, d, J=5Hz), 3.80(3H, s), 4.14(2H, s), 4.27(2H, q, J=7Hz), 4.81(2H, s), 5.39(2H, s), 6.15(1H, m), 6.97(1H, brs), 7.23-7.29(4H, m), 7.51(1H, brs), 8.20(1H, q,

$J=5\text{Hz}$), 8.53(1H, brs), 9.15(1H, brs), 9.80(1H, brs)

MS:m/e (ESI) 559.2 (MH⁺)

実施例 1158

3-(3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニルアミノ)-メチル)-1H-
ピリジン-2-オン;トリフルオロ酢酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1.28(3H, t, $J=7\text{Hz}$), 1.35-1.42(12H, m), 3.80(3H, s), 4.10-4.23(6H, m), 4.75(2H, s),
 5.38(2H, s), 6.14(1H, m), 6.96(1H, brs), 7.23(1H, brs), 7.26-7.32(4H, m), 9.00(1H,
 10 brs), 9.28(1H, brs)

MS:m/e (ESI) 565.3 (MH⁺)

実施例 1159

1-[3-第3ブチル-5-(3,4-ジヒドロキシピロリジン-1-イル)-4-メトキシフェニル]-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;塩酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1.29(3H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 1.37(9H, s), 1.40(3H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 2.92(2H, d, $J=10\text{Hz}$), 3.61(3H, s), 4.11(2H, q, $J=6.8\text{Hz}$), 4.21(2H, q, $J=6.8\text{Hz}$), 3.98-4.28(4H, m), 4.78(2H, s), 5.48(2H, s), 7.29(1H, s), 7.34(1H, s), 7.38(1H, s), 9.04(1H, brs), 9.29(1H, brs)

実施例 1160

1-(3-第3ブチル-4-メトキシ-5-モルフォリノ-フェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;塩酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1.29(3H, t, $J=6.8\text{Hz}$) 1.36(9H, s) 1.39(3H, t, $J=6.8\text{Hz}$) 2.94-3.08(4H, m) 3.76-3.85(4H, m)
 3.94(3H, s) 4.11(2H, q) 4.20(2H, q, $J=6.8\text{Hz}$) 4.77(2H, s) 5.49(2H, s) 7.32(1H, s) 7.49

(1H, s) 7.60 (1H, s)

以下の実施例化合物は、12mmΦ試験管中で少量多検体合成した。即ち2-イミノ-
ジヒドロピロロ[3,4-b]ピリジンまたは1-イミノイソインドリン、2-イミノピ
5 ロリジン、2-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イミダゾール、2-イミノ-2,3-ジヒドロ
1H-ベンズ-[d]-イミダゾールの各種アミジン誘導体(5mg)のジメチルホルムアミ
ド溶液(2ml)に各種2-ブロモ-1-エタノン誘導体(10mg)を加え室温で一晩攪拌し
た。反応終了後、窒素を吹き付けることにより溶媒を留去し残渣をLC-MS[展開溶
媒：0.1%トリフルオロ酢酸含有アセトニトリル溶液：0.1%トリフルオロ酢酸含有
10 水溶液=1:99～100:0/20分サイクル、流速:20ml/分、カラム:YMC Combiprep ODS-AM、
20mmΦx50mm(Long)]により精製分離し、標記化合物を得た。

実施例 1161

7-第3ブチル-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メチルベンゾフラン-3-カルボン酸；臭化水素酸塩

15 MS:m/e(ESI) 434.0 (MH+)

実施例 1162

3-第3ブチル-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-安息香酸；臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 396.2 (MH+)

20 実施例 1163

3-第3ブチル-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシ-安息香酸；臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 410.3 (MH+)

実施例 1164

25 3-第3ブチル-2-カルボキシメトキシ-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-安息香酸メチルエステル；臭化水素

酸塩MS:m/e(ESI) 468. 3 (MH⁺)

実施例 1165

{3-第3ブチル-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシベンゾイルアミノ}-酢酸;臭化水素酸塩

5

MS:m/e(ESI) 467. 4 (MH⁺)

実施例 1166

{(3-第3ブチル-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシベンゾイル}-メチルアミノ}-酢酸;臭化水素

10

酸塩MS:m/e(ESI) 481. 4 (MH⁺)

実施例 1167

1-(2-第3ブチル-ピリジン-4-イル)-2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

15

MS:m/e(ESI) 337. 4 (MH⁺)

実施例 1168

{2-第3ブチル-4-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-メトキシフェノキシ}-酢酸メチルエステル;臭化水素酸塩

20

MS:m/e(ESI) 454. 4 (MH⁺)

実施例 1169

{2-第3ブチル-6-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩MS:m/e(ESI) 410. 4 (MH⁺)

25

実施例 1170

{4-第3ブチル-2-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン

-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩MS:m/e(ESI) 410. 4(MH⁺)

実施例 1171

3-{3-第3ブチル-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジ5 ン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシフェニル}-プロピオン酸エチルエステル;臭化水素酸塩MS:m/e(ESI) 452. 4(MH⁺)

実施例 1172

N-{2-第3ブチル-4-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジ10 ン-6-イル)-アセチル]-フェニル}-メタンスルfonyアミド;臭化水素酸塩MS:m/e(ESI) 429. 4(MH⁺)

実施例 1173

3-{2-第3ブチル-4-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル}-プロピオン酸;臭化水素酸塩15 MS:m/e(ESI) 408. 4(MH⁺)

実施例 1174

3-{2-第3ブチル-4-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-プロピオン酸;臭化水素酸塩MS:m/e(ESI) 424. 4(MH⁺)

20 実施例 1175

{3-第3ブチル-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシフェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩MS:m/e(ESI) 440. 4(MH⁺)

実施例 1176

5-第3ブチル-7-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロベンゾ[1,4]ジオキサン-2-カルボン酸;臭化

水素酸塩MS:m/e (ESI) 438. 4 (MH⁺)

実施例 1177

1-(3, 5-Di-第 3 プチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-(2-エチル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩MS:m/e (ESI) 408. 5 (MH⁺)

実施例 1178

1-(7-エチル-3, 3-ジメチル-2, 3-ジヒドロ-ベンゾフラン-5-イル)-2-(2-エチル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン; 臭化水素酸10 塩MS:m/e (ESI) 378. 4 (MH⁺)

実施例 1179

N-[5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-3, 3-ジメチル-2, 3-ジヒドロ-ベンゾフラン-7-イル]-N-メチル-アセトア15 ミド; 臭化水素酸塩MS:m/e (ESI) 421. 4 (MH⁺)

実施例 1180

N-[3-エチル-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシフェニル]-N-メチル-メタンスルфонアミ20 ド; 臭化水素酸塩MS:m/e (ESI) 431. 4 (MH⁺)

実施例 1181

1-(7-第 3 プチル-2, 3-ジヒドロ-ベンゾフラン-5-イル)-2-(2-エチル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩25 MS:m/e (ESI) 378. 4 (MH⁺)

実施例 1182

7-第 3 プチル-5-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソ
インドール-2-イル)-アセチル]-2-メチルベンゾフラン-3-カルボン酸;臭化水素
酸塩

MS:m/e (ESI) 511. 4 (MH⁺)

5 実施例 1183

3-第 3 プチル-5-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソ
インドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-安息香酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 473. 4 (MH⁺)

実施例 1184

10 3-第 3 プチル-5-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソ
インドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-安息香酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 487. 4 (MH⁺)

実施例 1185

{3-第 3 プチル-5-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソ
インドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-ベンゾイルアミノ}-酢酸;臭化水素
酸塩

MS:m/e (ESI) 544. 5 (MH⁺)

実施例 1186

20 ({3-第 3 プチル-5-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-ベンゾイル}-メチルアミノ)-酢
酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 558. 5 (MH⁺)

実施例 1187

25 1-(2-第 3 プチル-ピリジン-4-イル)-2-(5, 6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ
-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 413. 5 (MH⁺)

実施例 1188

{2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソソインドール-2-イル)-アセチル]-6-メトキシフェノキシ}-酢酸メチルエステル;臭化水素酸塩

5 MS:m/e(ESI) 531.5 (MH⁺)

実施例 1189

3-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシフェニル}-プロピオン酸エチルエステル;臭化水素酸塩

10 MS:m/e(ESI) 529.4 (MH⁺)

実施例 1190

N-{2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-メタンスルfonylamido;臭化水素酸塩

15 MS:m/e(ESI) 506.4 (MH⁺)

実施例 1191

3-{2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 485.5 (MH⁺)

20 実施例 1192

3-{2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 501.5 (MH⁺)

実施例 1193

2-{2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-アセトアミド;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 486. 5 (MH^+)

実施例 1194

{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

5 MS: m/e (ESI) 517. 4 (MH^+)

実施例 1195

1-(3,5-Di-第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 485. 5 (MH^+)

10 実施例 1196

2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-1-(7-エチル-3,3-ジメチル-2,3-ジヒドロ-ベンゾフラン-5-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 455. 4 (MH^+)

15 実施例 1197

N-{5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-3,3-ジメチル-2,3-ジヒドロ-ベンゾフラン-7-イル}-N-メチルアセトアミド;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 498. 4 (MH^+)

20 実施例 1198

N-{5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-3-エチル-2-ヒドロキシフェニル}-N-メチルメタンスルfonyアミド;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 508. 4 (MH^+)

25 実施例 1199

1-(7-第3ブチル-2,3-ジヒドロ-ベンゾフラン-5-イル)-2-(5,6-ジエチキシ-7-フ

ルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸

塩

MS:m/e (ESI) 455. 4 (MH⁺)

実施例 1200

5 {8-第3ブチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソ
インドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-
酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 528. 5 (MH⁺)

実施例 1201

10 2-[2-(3,5-Di-第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキ
シ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸
塩

MS:m/e (ESI) 480. 5 (MH⁺)

実施例 1202

15 6-エトキシ-2-[2-(7-エチル-3,3-ジメチル-2,3-ジヒドロ-ベンゾフラン-5-イ
ル)-2-オキソ-エチル]-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン
酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 450. 4 (MH⁺)

実施例 1203

20 2-{2-[7-(アセチル-メチルアミノ)-3,3-ジメチル-2,3-ジヒドロ-ベンゾフラン
-5-イル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインド
ール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 493. 4 (MH⁺)

実施例 1204

25 6-エトキシ-2-{2-[3-エチル-4-ヒドロキシ-5-(メタンスルfonyl-メチルアミ
ノ)-フェニル]-2-オキソ-エチル}-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール

-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩MS:m/e (ESI) 503. 4 (MH⁺)

実施例 1205

2-[2-(7-第3ブチル-2,3-ジヒドロ-ベンゾフラン-5-イル)-2-オキソ-エチル]-6-

5 エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 450. 4 (MH⁺)

実施例 1206

3-第3ブチル-2-エトキシ-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ

10 [3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-安息香酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 423. 9 (MH⁺)

実施例 1207

3-第3ブチル-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-プロポキシ-安息香酸;臭化水素酸塩

15 MS:m/e (ESI) 438. 2 (MH⁺)

実施例 1208

3-第3ブチル-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-イソプロポキシ-安息香酸;臭化水素酸塩MS:m/e (ESI) 438. 3 (MH⁺)

20 実施例 1209

1-(3-第3ブチル-5-エトキシ-4-ヒドロキシフェニル)-2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩MS:m/e (ESI) 396. 4 (MH⁺)

実施例 1210

{2-第3ブチル-6-エトキシ-4-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 454. 4 (MH^+)

実施例 1211

1-(3-第 3 プチル-5-ヒドロキシ-4-メトキシフェニル)-2-(2-エチル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

5 MS: m/e (ESI) 382. 4 (MH^+)

実施例 1212

4-{3-[2-(2-エチル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル}-4-メチル-ペント-2-enoic acid エチル エステル; 臭化水素酸塩

10 MS: m/e (ESI) 420. 5 (MH^+)

実施例 1213

2-{3-[2-(2-エチル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル}-2-メチル-プロピオン酸 メチル エステル; 臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 380. 4 (MH^+)

15 実施例 1214

3-{3-第 3 プチル-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル}-プロピオン酸エチルエステル; 臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 466. 5 (MH^+)

20 実施例 1215

3-{3-第 3 プチル-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル}-プロピオン酸; 臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 438. 5 (MH^+)

実施例 1216

5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-3, 3-ジメチル-1, 3-ジヒドロ-インドール-2-オン; 臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 363.4(MH⁺)

実施例 1217

5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-1,3,3-トリメチル-1,3-ジヒドロ-インドール-2-オン;臭化水素酸塩

5 MS:m/e(ESI) 377.5(MH⁺)

実施例 1218

{5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-3,3-ジメチル-2-オキソ-2,3-ジヒドロ-インドール-1-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

10 MS:m/e(ESI) 421.5(MH⁺)

実施例 1219

1-(3-第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 352.5(MH⁺)

15 実施例 1220

3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-インドール-2-イル)-アセチル]-2-エトキシ-安息香酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 501.5(MH⁺)

実施例 1221

20 3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-インドール-2-イル)-アセチル]-2-プロポキシ-安息香酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 515.6(MH⁺)

実施例 1222

25 3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-インドール-2-イル)-アセチル]-2-イソプロポキシ-安息香酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 515.6(MH⁺)

実施例 1223

1-(3-第3ブチル-5-エトキシ-4-ヒドロキシフェニル)-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

5 MS:m/e(ESI) 473.5(MH⁺)

実施例 1224

{2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-エトキシフェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 531.6(MH⁺)

10 実施例 1225

1-(3-第3ブチル-5-ヒドロキシ-4-メトキシフェニル)-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 459.5(MH⁺)

15 実施例 1226

3-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル}-プロピオン酸エチルエステル;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 543.6(MH⁺)

20 実施例 1227

3-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル}-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 515.6(MH⁺)

25 実施例 1228

5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-

イル)-アセチル]-3, 3-ジメチル-1, 3-ジヒドロ-インドール-2-オン; 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 440. 5 (MH⁺)

実施例 1229

5-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-

5 イル)-アセチル]-1, 3, 3-トリメチル-1, 3-ジヒドロ-インドール-2-オン; 臭化水素
酸塩

MS:m/e (ESI) 454. 5 (MH⁺)

実施例 1230

{5-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-

10 イル)-アセチル]-3, 3-ジメチル-2-オキソ-2, 3-ジヒドロ-インドール-1-イル}-酢
酸; 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 498. 5 (MH⁺)

実施例 1231

1-[(3-第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-(5, 6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イ

15 ミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 429. 5 (MH⁺)

実施例 1232

3-第3ブチル-2-エトキシ-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル

-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-安息香酸; 臭化水素酸塩

20 MS:m/e (ESI) 496. 5 (MH⁺)

実施例 1233

3-第3ブチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ

-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-プロポキシ-安息香酸; 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 510. 5 (MH⁺)

25 実施例 1234

3-第3ブチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ

-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-イソプロポキシ-安息香酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 510.5 (MH⁺)

実施例 1235

2-[2-(3-第3ブチル-5-エトキシ-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-6-

5 エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化
水素酸塩

MS:m/e (ESI) 468.5 (MH⁺)

実施例 1236

{2-第3ブチル-6-エトキシ-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル

10 -1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水素
酸塩

MS:m/e (ESI) 526.5 (MH⁺)

実施例 1237

{3-第3ブチル-2-エトキシ-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ

15 [3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-ベンゾイルアミノ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 481.5 (MH⁺)

実施例 1238

2-{3-第3ブチル-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジ

ン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシ-ベンゾイルアミノ}-プロピオン酸;臭化水素

20 酸塩

MS:m/e (ESI) 481.5 (MH⁺)

実施例 1239

1-(3-第3ブチル-4-ピロリジン-1-イル-フェニル)-2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-

ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

25 MS:m/e (ESI) 405.5 (MH⁺)

実施例 1240

{2-第3ブチル-4-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニルアミノ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 409.4(MH⁺)

実施例 1241

5 {4-第3ブチル-6-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メチルベンゾイミダゾール-1-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 448.5(MH⁺)

実施例 1242

10 {2-[(アセチル-メチル-アミノ)-メチル]-6-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 572.5(MH⁺)

実施例 1243

15 {3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-エトキシベンゾイルアミノ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 558.5(MH⁺)

実施例 1244

20 2-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシベンゾイルアミノ}-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 558.5(MH⁺)

実施例 1245

25 {4-第3ブチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メチルベンゾイミダゾール-1-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 525.5 (MH^+)

実施例 1246

1-(8-第 3 ブチル-4-エチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イ
ル)-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-
イル)-エタノン;臭化水素酸塩

5

MS: m/e (ESI) 498.5 (MH^+)

実施例 1247

1-(8-第 3 ブチル-4-プロピル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イ
ル)-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-
イル)-エタノン;臭化水素酸塩

10

MS: m/e (ESI) 512.5 (MH^+)

実施例 1248

{3-第 3 ブチル-2-エトキシ-5-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2,4-ジメチル-5,7-ジヒ
ドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-ベンゾイルアミノ}-酢酸;臭化
水素酸塩

15

MS: m/e (ESI) 525.5 (MH^+)

実施例 1249

2-{3-第 3 ブチル-5-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2,4-ジメチル-5,7-ジヒドロ-ピロ
ロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシ-ベンゾイルアミノ}-プロピ
オン酸;臭化水素酸塩

20

MS: m/e (ESI) 525.5 (MH^+)

実施例 1250

1-(3-第 3 ブチル-4-ピロリジン-1-イル-フェニル)-2-(3-エトキシ-7-イミノ
-2,4-ジメチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水
素酸塩

25

MS: m/e (ESI) 449.5 (MH^+)

実施例 1251

{2-第3ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2,4-ジメチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニルアミノ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 453.5 (MH⁺)

5 実施例 1252

{2-[(アセチル-メチル-アミノ)-メチル]-6-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 567.5 (MH⁺)

10 実施例 1253

{3-第3ブチル-2-エトキシ-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-2-イル)-アセチル]-ベンゾイルアミノ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 553.5 (MH⁺)

15 実施例 1254

2-{3-第3ブチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-ベンゾイルアミノ}-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 553.5 (MH⁺)

20 実施例 1255

2-[2-(3-第3ブチル-4-ピロリジン-1-イル-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 477.5 (MH⁺)

25 実施例 1256

{2-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒド

ロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニルアミノ}-酢酸;臭化水素酸塩MS:m/e (ESI) 481.5 (MH⁺)

実施例 1257

[4-第 3 プチル-6-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メチルベンゾイミダゾール-1-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 520.5 (MH⁺)

実施例 1258

2-[2-(8-第 3 プチル-4-エチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 493.5 (MH⁺)

実施例 1259

2-[2-(8-第 3 プチル-4-プロピル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 507.5 (MH⁺)

実施例 1260

2-アセチルアミノ-3-[2-第 3 プチル-4-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル]-アクリル酸 メチル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 477.2 (MH⁺)

実施例 1261

3-[3-第 3 プチル-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシ-ベンゾイルアミノ]-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 481. 2 (MH⁺)

実施例 1262

N-[2-(第3ブチル-4-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル]-N-メチルsuccinamic acid;臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 465. 3 (MH⁺)

実施例 1263

8-第3ブチル-6-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-4-メチル-4H-ベンゾ[1,4]オキサジン-3-オン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 421. 4 (MH⁺)

10 実施例 1264

8-第3ブチル-6-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-4H-ベンゾ[1,4]オキサジン-3-オン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 407. 4 (MH⁺)

実施例 1265

15 1-(3-第3ブチル-4,5-ジメトキシフェニル)-2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 396. 4 (MH⁺)

実施例 1266

20 1-(5-第3ブチル-フラン-3-yl)-2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 326. 4 (MH⁺)

実施例 1267

25 2-アセチルアミノ-3-{2-第3ブチル-4-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル}-プロピオニ酸メチルエス
テル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 479. 2 (MH⁺)

実施例 1268

2-アセチルアミノ-3-{2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-1ソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-アクリル酸メチルエステル;臭化水素酸塩

5 MS:m/e(ESI) 554.5(MH⁺)

実施例 1269

3-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-1ソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-ベンゾイルアミノ}-プロピオン酸;臭化水素酸塩

10 MS:m/e(ESI) 558.5(MH⁺)

実施例 1270

N-{2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-1ソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-N-メチルsuccinamic acid;臭化水素酸塩

15 MS:m/e(ESI) 542.5(MH⁺)

実施例 1271

8-第3ブチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-1ソインドール-2-イル)-アセチル]-4-メチル-4H-ベンゾ[1,4]オキサジン-3-オン;臭化水素酸塩

20 MS:m/e(ESI) 498.4(MH⁺)

実施例 1272

5-第3ブチル-7-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-1ソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]ジオキサン-2-カルボン酸;臭化水素酸塩

25 MS:m/e(ESI) 515.4(MH⁺)

実施例 1273

1-(3-第3ブチル-4,5-ジメトキシフェニル)-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 473.4(MH⁺)

実施例 1274

5 1-(5-第3ブチル-フラン-3-イル)-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 403.4(MH⁺)

実施例 1275

10 2-アセチルアミノ-3-{2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-プロピオン酸メチルエステル;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 556.3(MH⁺)

実施例 1276

15 2-アセチルアミノ-3-{2-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-アクリル酸メチルエステル;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 549.2(MH⁺)

実施例 1277

20 3-{3-第3ブチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシベンゾイルアミノ}-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 553.3(MH⁺)

実施例 1278

25 N-{2-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-N-メチルsuccinamic acid;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 537. 4 (MH⁺)

実施例 1279

2-[2-(8-第 3 プチル-4-メチル-3-オキソ-3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキサジン-6-イル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

5

MS:m/e (ESI) 493. 4 (MH⁺)

実施例 1280

2-[2-(8-第 3 プチル-3-オキソ-3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキサジン-6-イル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

10

MS:m/e (ESI) 479. 4 (MH⁺)

実施例 1281

2-[2-(4-アセチル-8-第 3 プチル-3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキサジン-6-イル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

15

MS:m/e (ESI) 507. 4 (MH⁺)

実施例 1282

2-[2-(3-第 3 プチル-4-ヒドロキシ-5-ニトロフェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

20

MS:m/e (ESI) 469. 2 (MH⁺)

実施例 1283

5-第 3 プチル-7-[2-(6-カルバモイル-5-エトキシ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-1ソイソンドール-2-イル)-アセチル]-2, 3-ジヒドロ-ベンゾ[1, 4]ジオキサン-2-カルボン酸; 臭化水素酸塩

25

MS:m/e (ESI) 496. 4 (MH⁺)

実施例 1284

2-[2-(3-第3ブチル-4,5-ジメトキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 アミド;臭化水素酸塩

5 MS:m/e(ESI) 454.4(MH⁺)

実施例 1285

2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-1-(1,3,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インドール-5-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

10 MS:m/e(ESI) 363.4(MH⁺)

実施例 1286

6-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-1,4,4-トリメチル-3,4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オン;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 391.4(MH⁺)

15 実施例 1287

1-[3-第3ブチル-4-(1H-テトラゾール-5-イルメトキシ)-フェニル]-2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 434.4(MH⁺)

20 実施例 1288

2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-1-(1,2,3,3-テトラメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インドール-5-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 377.4(MH⁺)

25 実施例 1289

1-(7-第3ブチル-3,3-ジメチル-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[b]チオフェン-5-イ

ル)-2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 422. 4 (MH⁺)

実施例 1290

5 1-(8-第3ブチル-4,4-ジメチル-チオクロマン-6-イル)-2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 436. 4 (MH⁺)

実施例 1291

10 2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-1-(1,3,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インドール-5-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 440. 5 (MH⁺)

実施例 1292

15 6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-1,4,4-トリメチル-3,4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 468. 5 (MH⁺)

実施例 1293

20 2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-1-(1,2,3,3-テトラメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インドール-5-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 454. 5 (MH⁺)

実施例 1294

25 1-(7-第3ブチル-3,3-ジメチル-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[b]チオフェン-5-イル)-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 499. 5 (MH^+)

実施例 1295

1-(8-第 3 プチル-4, 4-ジメチル-チオクロマン-6-イル)-2-(5, 6-ジエチキシ-7-フ
ルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 臭化水素酸

5 塩

MS: m/e (ESI) 513. 5 (MH^+)

実施例 1296

4-{8-第 3 プチル-6-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒ
ドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2, 3-ジヒドロ-ベンゾ[1, 4]オキサジン
-4-イル}-4-オキソ-ブタン酸 エチル エステル; 臭化水素酸塩

10

MS: m/e (ESI) 593. 6 (MH^+)

実施例 1297

2-[2-(7-第 3 プチル-3, 3-ジメチル-2, 3-ジヒドロ-ベンゾ[b]チオフェン-5-イ
ル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール
-5-酢酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

15

MS: m/e (ESI) 494. 5 (MH^+)

実施例 1298

{2-[(アセチル-メチル-アミノ)-メチル]-6-第 3 プチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イ
ミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノ
キシ}-酢酸; 臭化水素酸塩

20

MS: m/e (ESI) 544. 5 (MH^+)

実施例 1299

2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-1-(1, 3, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インドール-5-イル)-エタノン; 臭化
水素酸塩

25

MS: m/e (ESI) 412. 4 (MH^+)

実施例 1300

1-[3-第3ブチル-4-(1H-テトラゾール-5-イルメトキシ)-フェニル]-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;
臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 483.4 (MH⁺)

実施例 1301

{2-[(アセチル-メチル-アミノ)-メチル]-6-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-6-メトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

10 MS:m/e (ESI) 558.5 (MH⁺)

実施例 1302

(アセチル-{3-第3ブチル-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジル}-アミノ)-酢酸;臭化水素酸塩

15 MS:m/e (ESI) 481.1 (MH⁺)

実施例 1303

{3-第3ブチル-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジルアミノ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 439.1 (MH⁺)

実施例 1304

4-{3-第3ブチル-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 454.2 (MH⁺)

実施例 1305

25 4-{3-第3ブチル-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェノキシ}-ブチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 453. 2 (MH⁺)

実施例 1306

4-{2-第3ブチル-4-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-メトキシフェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

5 MS:m/e(ESI) 468. 3 (MH⁺)

実施例 1307

4-{2-第3ブチル-4-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-メトキシフェノキシ}-ブチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 467. 4 (MH⁺)

10 実施例 1308

1-(8-第3ブチル-4,4-ジメチル-1,1-ジオキソ-11lambda*6*-チオクロマン-6-イル)-2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 468. 4 (MH⁺)

15 実施例 1309

1-(8-第3ブチル-4,4-ジメチル-クロマン-6-イル)-2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 420. 4 (MH⁺)

実施例 1310

20 {2-第3ブチル-4-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 394. 4 (MH⁺)

実施例 1311

25 {2-第3ブチル-4-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-チオフェン-2-イルフェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 492. 4 (MH⁺)

実施例 1312

2-{2-第3ブチル-4-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 424. 4 (MH⁺)

5 実施例 1313

[2-第3ブチル-4-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(メタンスルfonylメチルアミノ)-フェノキシ]-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 517. 4 (MH⁺)

10 実施例 1314

(アセチル-{3-第3ブチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシベンジル}-アミノ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 553. 5 (MH⁺)

15 実施例 1315

{3-第3ブチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシベンジルアミノ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 511. 5 (MH⁺)

20 実施例 1316

4-{3-第3ブチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシフェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 526. 5 (MH⁺)

25 実施例 1317

2-{2-[3-第3ブチル-5-(3-カルバモイル-プロポキシ)-4-ヒドロキシフェニ

ル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール

-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 525.5 (MH⁺)

実施例 1318

5 4-{2-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-メトキシフェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 540.5 (MH⁺)

実施例 1319

10 2-{2-[3-第3ブチル-4-(3-カルバモイル-プロポキシ)-5-メトキシフェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソイゾドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 539.5 (MH⁺)

実施例 1320

15 2-[2-(8-第3ブチル-4,4-ジメチル-1,1-ジオキソ-11lambda*6*-チオクロマン-6-イル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 540.5 (MH⁺)

実施例 1321

20 2-[2-(8-第3ブチル-4,4-ジメチル-クロマン-6-イル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 492.5 (MH⁺)

実施例 1322

25 {2-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 466. 4 (MH⁺)

実施例 1323

[2-第 3 プチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-チオフェン-2-イル-フェノキシ]-酢酸; 臭化水素酸塩

5 酸; 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 564. 5 (MH⁺)

実施例 1324

[2-第 3 プチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(メタンスルfonylメチル-アミノ)-フェノキシ]-酢酸; 臭化水素酸塩

10 10

MS:m/e (ESI) 589. 5 (MH⁺)

実施例 1325

4-{3-第 3 プチル-5-[2-(6-カルバモイル-5-エトキシ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシフェノキシ}-ブタン酸; 臭化水

15 素酸塩

MS:m/e (ESI) 512. 5 (MH⁺)

実施例 1326

2-{2-[3-第 3 プチル-5-(3-カルバモイル-プロポキシ)-4-ヒドロキシフェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 アミド; 臭化水素酸塩

20 20

MS:m/e (ESI) 511. 5 (MH⁺)

実施例 1327

4-{2-第 3 プチル-4-[2-(6-カルバモイル-5-エトキシ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-メトキシフェノキシ}-ブタン酸; 臭化水素酸塩

25 25

MS:m/e (ESI) 526. 4 (MH⁺)

実施例 1328

2-[2-[3-第3ブチル-4-(3-カルバモイル-プロポキシ)-5-メトキシフェニル]-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 アミド;臭化水素酸塩

5 MS:m/e(ESI) 525.4(MH⁺)

実施例 1329

2-[2-(8-第3ブチル-4,4-ジメチル-1,1-ジオキソ-11lambda*6*-チオクロマン-6-イル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 アミド;臭化水素酸塩

10 MS:m/e(ESI) 526.2(MH⁺)

実施例 1330

2-[2-(8-第3ブチル-4,4-ジメチル-クロマン-6-イル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 アミド;臭化水素酸塩

15 MS:m/e(ESI) 478.4(MH⁺)

実施例 1331

4-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-1イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシフェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

20 MS:m/e(ESI) 531.4(MH⁺)

実施例 1332

4-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-1イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシフェノキシ}-ブチルアミド;臭化水素酸塩

25 MS:m/e(ESI) 530.4(MH⁺)

実施例 1333

4-{2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-1ソインドール-2-イル)-アセチル]-6-メトキシフェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 545.4(MH⁺)

5 実施例 1334

4-{2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-1ソインドール-2-イル)-アセチル]-6-メトキシフェノキシ}-ブチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 544.4(MH⁺)

10 実施例 1335

1-(8-第3ブチル-4,4-ジメチル-1,1-ジオキソ-11lambda*6*-チオクロマン-6-イル)-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-1ソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 545.4(MH⁺)

15 実施例 1336

1-(8-第3ブチル-4,4-ジメチル-クロマン-6-イル)-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-1ソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 497.4(MH⁺)

実施例 1337

20 {2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-1ソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 471.4(MH⁺)

実施例 1338

25 {2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-1ソインドール-2-イル)-アセチル]-6-チオフェン-2-イル-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 569. 3 (MH+)

実施例 1339

2-[2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-1イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ]-プロピオン酸;臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 501. 4 (MH+)

実施例 1340

[2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-1イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(メタンスルフォニル-メチル-アミノ)-フェノキシ]-酢酸;臭化水素酸塩

10 MS:m/e (ESI) 594. 4 (MH+)

実施例 1341

{6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-1イソインドール-2-イル)-アセチル]-4,4-ジメチル-2-オキソ-3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

15 MS:m/e (ESI) 512. 3 (MH+)

実施例 1342

(アセチル-{3-第3ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-1イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジル}-アミノ)-酢酸;臭化水素酸塩

20 MS:m/e (ESI) 530. 4 (MH+)

実施例 1343

{3-第3ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-1イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジルアミノ}-酢酸;臭化水素酸塩

25 MS:m/e (ESI) 488. 3 (MH+)

実施例 1344

{2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソ

インドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 443.3(MH⁺)

実施例 1345

5 {2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソ

インドール-2-イル)-アセチル]-6-チオフェン-2-イル-フェノキシ}-酢酸;臭化水

素酸塩

MS:m/e(ESI) 541.4(MH⁺)

実施例 1346

10 2-{2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イ

ソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 473.3(MH⁺)

実施例 1347

{6-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-

15 -イル)-アセチル]-4,4-ジメチル-2-オキソ-3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル}-

酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 484.3(MH⁺)

実施例 1348

{2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソ

20 インドール-2-イル)-アセチル]-6-ジメチルアミノ-フェノキシ}-酢酸;臭化水素

酸塩

MS:m/e(ESI) 530.1(MH⁺)

実施例 1349

{2-第3ブチル-4-[2-(6-カルバモイル-5-エトキシ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソ

25 インドール-2-イル)-アセチル]-6-ジメチルアミノ-フェノキシ}-酢酸;臭化水素

酸塩

MS: m/e (ESI) 511. 2 (MH^+)

実施例 1350

{2-第 3 プチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(1-イミノ-5-イソプロポキシ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

5

MS: m/e (ESI) 539. 3 (MH^+)

実施例 1351

{2-第 3 プチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(1-イミノ-6-メチルカルバモイル-5-イソプロポキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;

10

臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 539. 3 (MH^+)

実施例 1352

{2-第 3 プチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(1-イミノ-5-メトキシ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭

15

化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 511. 4 (MH^+)

実施例 1353

{2-第 3 プチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭

20

化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 525. 4 (MH^+)

実施例 1354

{2-第 3 プチル-4-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ジエチルアミノ-フェノキシ}-酢酸;臭化水素

25

酸塩

MS: m/e (ESI) 558. 4 (MH^+)

実施例 1355

{2-第3ブチル-4-[2-(6-カルバモイル-5-エトキシ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ジエチルアミノフェノキシ}-酢酸；臭化水素酸塩

5 MS:m/e(ESI) 539.4 (MH+)

実施例 1356

{2-第3ブチル-6-ジエチルアミノ-4-[2-(1-イミノ-5-イソプロポキシ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸；臭化水素酸塩

10 MS:m/e(ESI) 567.5 (MH+)

実施例 1357

{2-第3ブチル-6-ジエチルアミノ-4-[2-(1-イミノ-6-メチルカルバモイル-5-プロポキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸；臭化水素酸塩

15 MS:m/e(ESI) 567.5 (MH+)

実施例 1358

{2-第3ブチル-6-ジエチルアミノ-4-[2-(1-イミノ-5-メトキシ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸；臭化水素酸塩

20 MS:m/e(ESI) 539.5 (MH+)

実施例 1359

(アセチル-{2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-アミノ)-酢酸；臭化水素酸塩

25 MS:m/e(ESI) 528.5 (MH+)

実施例 1360

(アセチル-{2-第3ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2,4-ジメチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル}-アミノ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 495.5 (MH⁺)

5 実施例 1361

(アセチル-{2-第3ブチル-4-[2-(6-カルバモイル-5-エトキシ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-アミノ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 509.5 (MH⁺)

10 実施例 1362

(アセチル-{2-第3ブチル-4-[2-(1-イミノ-5-イソプロポキシ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-アミノ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 537.5 (MH⁺)

15 実施例 1363

(アセチル-{2-第3ブチル-4-[2-(1-イミノ-6-メチルカルバモイル-5-プロポキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-アミノ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 537.5 (MH⁺)

20 実施例 1364

(アセチル-{2-第3ブチル-4-[2-(1-イミノ-5-メトキシ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-アミノ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 509.5 (MH⁺)

25 実施例 1365

({2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イ

ソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-メチル-アミノ)-酢酸;臭化水素酸

塩

MS: m/e (ESI) 500.5(MH⁺)

実施例 1366

5 ({2-第 3 プチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2,4-ジメチル-5,7-ジヒドロ-ピロ
ロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル}-メチル-アミノ)-酢酸;臭化水
素酸塩

MS: m/e (ESI) 467.5(MH⁺)

実施例 1367

10 ({2-第 3 プチル-4-[2-(6-カルバモイル-5-エトキシ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-メチル-アミノ)-酢酸;臭化水素酸
塩

MS: m/e (ESI) 481.5(MH⁺)

実施例 1368

15 ({2-第 3 プチル-4-[2-(1-イミノ-5-イソプロポキシ-6-メチルカルバモイル-1,3-
ジヒドロ-イソソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-メチル-アミノ)-酢酸;
臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 509.5(MH⁺)

実施例 1369

20 ({2-第 3 プチル-4-[2-(1-イミノ-6-メチルカルバモイル-5-プロポキシ-1,3-ジヒ
ドロ-イソソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-メチル-アミノ)-酢酸;臭化
水素酸塩

MS: m/e (ESI) 509.5(MH⁺)

実施例 1370

25 ({2-第 3 プチル-4-[2-(1-イミノ-5-メトキシ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒド
ロ-イソソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-メチル-アミノ)-酢酸;臭化水

素酸塩MS: m/e (ESI) 481. 5(MH⁺)

実施例 1371

5 1-(3-第 3 プチル-4-ヒドロキシ-5-イソプロポキシフェニル)-2-(5, 6-ジエチキ
シ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 臭化
水素酸塩

MS: m/e (ESI) 487. 5(MH⁺)

実施例 1372

10 2-[2-(3-第 3 プチル-4-ヒドロキシ-5-イソプロポキシフェニル)-2-オキソ-エチ
ル]-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 アミ
ド; 臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 468. 5(MH⁺)

実施例 1373

15 7-第 3 プチル-9-[2-(2-エチル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン
-6-イル)-アセチル]-6-オキサ-10b-アザ-ベンゾ[^e]アズレン-4-オン; 臭化水素酸
塩

MS: m/e (ESI) 457. 4(MH⁺)

実施例 1374

20 {8-第 3 プチル-6-[2-(2-エチル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン
-6-イル)-アセチル]-3-オキソ-2, 3-ジヒドロ-ベンゾ[1, 4]オキサジン-4-イル}-
酢酸; 臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 465. 4(MH⁺)

実施例 1375

25 3-{8-第 3 プチル-6-[2-(2-エチル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジ
ン-6-イル)-アセチル]-2, 3-ジヒドロ-ベンゾ[1, 4]オキサジン-4-イル}-プロピオ
ン酸; 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 465.4 (MH⁺)

実施例 1376

2-[8-第3ブチル-6-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-プロピオ
ン酸;臭化水素酸塩

5

MS:m/e (ESI) 465.4 (MH⁺)

実施例 1377

2-[8-第3ブチル-6-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-2-メチル
-プロピオン酸;臭化水素酸塩

10

MS:m/e (ESI) 479.5 (MH⁺)

実施例 1378

2-[2-(7-第3ブチル-4-オキソ-4,5-ジヒドロ-6-オキサ-10b-アザ-ベンゾ[e]アズ
レン-9-イル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソイ
ンドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

15

MS:m/e (ESI) 529.5 (MH⁺)

実施例 1379

{8-第3ブチル-6-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒド
ロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-3-オキソ-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オ
キサジン-4-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

20

MS:m/e (ESI) 537.5 (MH⁺)

実施例 1380

3-{8-第3ブチル-6-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒ
ドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン
-4-イル}-プロピオン酸;臭化水素酸塩

25

MS:m/e (ESI) 537.5 (MH⁺)

実施例 1381

7-第 3 プチル-9-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソ
インドール-2-イル)-アセチル]-6-オキサ-10b-アザ-ベンゾ[e]アズレン-4-オン;
臭化水素酸塩

5 MS:m/e(ESI) 534. 5 (MH⁺)

実施例 1382

7-第 3 プチル-9-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソ
インドール-2-イル)-アセチル]-6-オキサ-10b-アザ-ベンゾ[e]アズレン-4-オン;
臭化水素酸塩

10 MS:m/e(ESI) 542. 5 (MH⁺)

実施例 1383

3-{8-第 3 プチル-6-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-2, 3-ジヒドロ-ベンゾ[1, 4]オキサジン-4-イ
ル}-プロピオニ酸; 臭化水素酸塩

15 MS:m/e(ESI) 542. 5 (MH⁺)

実施例 1384

7-第 3 プチル-9-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソ
インドール-2-イル)-アセチル]-6-オキサ-10b-アザ-ベンゾ[e]アズレン-4-オン;
臭化水素酸塩

20 MS:m/e(ESI) 506. 4 (MH⁺)

実施例 1385

{8-第 3 プチル-6-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソ
インドール-2-イル)-アセチル]-3-オキソ-2, 3-ジヒドロ-ベンゾ[1, 4]オキサジン
-4-イル}-酢酸; 臭化水素酸塩

25 MS:m/e(ESI) 514. 4 (MH⁺)

実施例 1386

3-{8-第3ブチル-6-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 514. 4 (MH⁺)

5 実施例 1387

3-{3-第3ブチル-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジルアミノ}-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 453. 4 (MH⁺)

10 実施例 1388

3-(アセチル-{3-第3ブチル-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジル}-アミノ)-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 495. 4 (MH⁺)

15 実施例 1389

{2-第3ブチル-4-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-メチルアミノメチルフェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 453. 4 (MH⁺)

実施例 1390

20 4-{8-第3ブチル-6-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 479. 4 (MH⁺)

実施例 1391

25 4-{2-第3ブチル-4-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イルフェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸

塩MS:m/e (ESI) 507. 5 (MH⁺)

実施例 1392

5-{2-第3ブチル-4-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩MS:m/e (ESI) 521. 5 (MH⁺)

実施例 1393

[2-第3ブチル-4-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン10-6-イル)-アセチル]-6-(2-オキソ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;臭化水素酸塩MS:m/e (ESI) 493. 4 (MH⁺)

実施例 1394

4-{2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ15-[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩MS:m/e (ESI) 519. 5 (MH⁺)

実施例 1395

5-{2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ20-[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩MS:m/e (ESI) 533. 5 (MH⁺)

実施例 1396

3-{3-第3ブチル-5-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル25-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジルアミノ}-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 524. 2 (MH⁺)

実施例 1397

3-(アセチル-{3-第3ブチル-5-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジル}-アミノ)-プロピオン酸;臭化水素酸塩

5

MS:m/e (ESI) 566. 5 (MH⁺)

実施例 1398

{2-第3ブチル-4-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-メチルアミノメチルフェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

10

MS:m/e (ESI) 524. 4 (MH⁺)

実施例 1399

4-{8-第3ブチル-6-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-ブタン酸;臭化水素酸塩

15

MS:m/e (ESI) 550. 5 (MH⁺)

実施例 1400

4-{2-第3ブチル-4-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

20

MS:m/e (ESI) 578. 5 (MH⁺)

実施例 1401

5-{2-第3ブチル-4-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ペンタノン酸;臭化水素酸塩

25

MS:m/e (ESI) 592. 6 (MH⁺)

実施例 1402

[2-第 3 プチル-4-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-
ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(2-オキソ-ピロリジン-1-イ
ル)-フェノキシ]-酢酸;臭化水素酸塩

5 MS:m/e(ESI) 564.5(MH⁺)

実施例 1403

{2-第 3 プチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチル
カルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-
酢酸;臭化水素酸塩

10 MS:m/e(ESI) 524.5(MH⁺)

実施例 1404

3-{3-第 3 プチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒ
ドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジルアミノ}-プロ
ピオン酸;臭化水素酸塩

15 MS:m/e(ESI) 525.5(MH⁺)

実施例 1405

3-(アセチル-{3-第 3 プチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル
-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジル}-ア
ミノ)-プロピオン酸;臭化水素酸塩

20 MS:m/e(ESI) 567.5(MH⁺)

実施例 1406

{2-第 3 プチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒド
ロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-メチルアミノメチルフェノキシ}-酢
酸;臭化水素酸塩

25 MS:m/e(ESI) 525.5(MH⁺)

実施例 1407

4-{8-第3ブチル-6-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 551.5 (MH⁺)

5 実施例 1408

4-{2-第3ブチル-4-[2-(6-カルバモイル-5-エトキシ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 565.5 (MH⁺)

10 実施例 1409

5-{2-第3ブチル-4-[2-(6-カルバモイル-5-エトキシ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 579.5 (MH⁺)

15 実施例 1410

[2-第3ブチル-4-[2-(6-カルバモイル-5-エトキシ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(2-オキソ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 551.4 (MH⁺)

20 実施例 1411

3-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジルアミノ}-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 530.5 (MH⁺)

25 実施例 1412

3-(アセチル-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-

ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジル}-アミノ)-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 572. 5 (MH+)

実施例 1413

5 {2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-メチルアミノメチルフェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 530. 5 (MH+)

実施例 1414

10 4-{8-第3ブチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 556. 5 (MH+)

実施例 1415

15 3-{3-第3ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジルアミノ}-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 502. 4 (MH+)

実施例 1416

20 3-(アセチル-{3-第3ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジル}-アミノ)-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 544. 4 (MH+)

実施例 1417

25 {2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-メチルアミノメチルフェノキシ}-酢酸;臭化

水素酸塩MS:m/e(ESI) 502. 4 (MH⁺)

実施例 1418

4-{8-第3ブチル-6-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 528. 4 (MH⁺)

実施例 1419

4-{2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 556. 4 (MH⁺)

実施例 1420

5-{2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 570. 5 (MH⁺)

実施例 1421

[2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(2-オキソ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 542. 4 (MH⁺)

実施例 1422

[2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 507. 4 (MH⁺)

実施例 1423

[2-第 3 プチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;臭化水素酸塩

5

MS:m/e (ESI) 567. 4 (MH⁺)

実施例 1424

[2-第 3 プチル-4-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;臭化水素酸塩

10

MS:m/e (ESI) 566. 5 (MH⁺)

実施例 1425

[2-第 3 プチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;臭化水素酸塩

15

MS:m/e (ESI) 572. 4 (MH⁺)

実施例 1426

[2-第 3 プチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;臭化水素酸塩

20

MS:m/e (ESI) 544. 4 (MH⁺)

実施例 1427

(1-{3-第 3 プチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェニル}-ピロリジン-3-イ

25

ルオキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 507. 1 (MH⁺)

実施例 1428

(1-[3-第 3 プチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシフェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 567. 2 (MH⁺)

実施例 1429

(1-[3-第 3 プチル-5-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシフェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

10 MS:m/e (ESI) 566. 3 (MH⁺)

実施例 1430

(1-[3-第 3 プチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシフェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

15 MS:m/e (ESI) 572. 3 (MH⁺)

実施例 1431

(1-[3-第 3 プチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシフェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

20 MS:m/e (ESI) 544. 3 (MH⁺)

実施例 1432

1-[3-第 3 プチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシベンジル}-5-オキソ-ピロリジン-2-カルボン酸;臭化水素酸塩

25 MS:m/e (ESI) 505. 4 (MH⁺)

実施例 1433

1-{3-第3ブチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジル}-5-オキソ-ピロリジン-2-カルボン酸;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 565.4(MH⁺)

5 実施例 1434

1-{3-第3ブチル-5-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジル}-5-オキソ-ピロリジン-2-カルボン酸;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 564.4(MH⁺)

10 実施例 1435

1-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジル}-5-オキソ-ピロリジン-2-カルボン酸;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 570.4(MH⁺)

15 実施例 1436

1-{3-第3ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジル}-5-オキソ-ピロリジン-2-カルボン酸;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 542.4(MH⁺)

20 実施例 1437

{2-シクロペンチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 499.3(MH⁺)

実施例 1438

25 {2-シクロペンチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 434. 3 (MH^+)

実施例 1439

1-(7-第3ブチル-2-メチルベンゾオキサゾール-5-イル)-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素

5 酸塩

MS: m/e (ESI) 468. 4 (MH^+)

実施例 1440

1-(7-第3ブチル-2-メチルベンゾオキサゾール-5-イル)-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸

10 塩

MS: m/e (ESI) 403. 4 (MH^+)

実施例 1441

4-{2-第3ブチル-4-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-メトキシフェノキシ}-ブ

15 タン酸;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 539. 5 (MH^+)

実施例 1442

4-{2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-メトキシフェノキシ}-ブタン酸;臭化水

20 素酸塩

MS: m/e (ESI) 480. 4 (MH^+)

実施例 1443

2-{2-[3-第3ブチル-4-(3-カルバモイル-プロポキシ)-5-メトキシフェニル]-2-オキソ-エチル}-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 538. 5 (MH^+)

実施例 1444

4-{2-第 3 プチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-メトキシフェノキシ}-ブチルアミド;臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 479. 5 (MH⁺)

実施例 1445

{2-第 3 プチル-4-[2-(6-カルバモイル-5-エトキシ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-モルフォリン-4-イルフェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

10 MS:m/e (ESI) 553. 5 (MH⁺)

実施例 1446

{2-第 3 プチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-モルフォリン-4-イルフェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

15 MS:m/e (ESI) 507. 5 (MH⁺)

実施例 1447

2-{2-[3-(アセチルメチルアミノ)-5-第 3 プチル-4-(3-カルバモイル-プロポキシ)-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

20 MS:m/e (ESI) 580. 6 (MH⁺)

実施例 1448

4-{3-第 3 プチル-2-ヒドロキシ-5-[2-(1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 424. 1 (MH⁺)

25 実施例 1449

4-{3-第 3 プチル-5-[2-(6-エトキシ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-

イル)-アセチル]-2-ヒドロキシフェノキシ}-ブチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 468. 2(MH⁺)

実施例 1450

4-{3-第3ブチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-

5 イル)-アセチル]-2-ヒドロキシフェノキシ}-ブチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 468. 3(MH⁺)

実施例 1451

4-{3-第3ブチル-2-ヒドロキシ-5-[2-(1-イミノ-5-メトキシ-1,3-ジヒドロ-イソ

インドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブチルアミド;臭化水素酸塩

10 MS:m/e(ESI) 454. 3(MH⁺)

実施例 1452

4-{3-第3ブチル-5-[2-(6-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-

イル)-アセチル]-2-ヒドロキシフェノキシ}-ブチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 442. 3(MH⁺)

15 実施例 1453

4-{3-第3ブチル-5-[2-(5-エトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソイ

ンドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシフェノキシ}-ブチルアミド;臭化水

素酸塩

MS:m/e(ESI) 486. 4(MH⁺)

20 実施例 1454

4-{3-第3ブチル-5-[2-(1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセ

チル]-2-メトキシフェノキシ}-ブチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 438. 4(MH⁺)

実施例 1455

4-{3-第3ブチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-

イル)-アセチル]-2-メトキシフェノキシ}-ブチルアミド;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 482. 5 (MH^+)

実施例 1456

4-[3-第3ブチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェノキシ]-ブチルアミド;臭化水素酸塩

5 MS: m/e (ESI) 482. 5 (MH^+)

実施例 1457

4-[3-第3ブチル-5-[2-(1-イミノ-5-メトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェノキシ]-ブチルアミド;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 468. 4 (MH^+)

10 実施例 1458

4-[3-第3ブチル-5-[2-(6-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェノキシ]-ブチルアミド;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 456. 4 (MH^+)

実施例 1459

15 4-[3-第3ブチル-5-[2-(5-エトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェノキシ]-ブチルアミド;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 500. 5 (MH^+)

実施例 1460

20 [2-第3ブチル-4-[2-(6-エトキシ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 510. 4 (MH^+)

実施例 1461

25 [2-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;臭化水素酸塩

素酸塩

MS:m/e (ESI) 510. 4 (MH+)

実施例 1462

{2-第3ブチル-6-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-4-[2-(1-イミノ-5-メトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水

5

素酸塩

MS:m/e (ESI) 496. 4 (MH+)

実施例 1463

[2-第3ブチル-4-[2-(6-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;臭化水

10

素酸塩

MS:m/e (ESI) 484. 3 (MH+)

実施例 1464

[2-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;臭化水素酸塩

15

MS:m/e (ESI) 528. 3 (MH+)

実施例 1465

(1-{3-第3ブチル-2-ヒドロキシ-5-[2-(1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

20

MS:m/e (ESI) 466. 4 (MH+)

実施例 1466

(1-{3-第3ブチル-5-[2-(6-エトキシ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシフェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

25

MS:m/e (ESI) 510. 4 (MH+)

実施例 1467

(1-{3-第 3 プチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシフェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸;
臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 510.4 (MH⁺)

実施例 1468

(1-{3-第 3 プチル-2-ヒドロキシ-5-[2-(1-イミノ-5-メトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸;
臭化水素酸塩

10 MS:m/e (ESI) 496.4 (MH⁺)

実施例 1469

(1-{3-第 3 プチル-5-[2-(6-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシフェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸;
臭化水素酸塩

15 MS:m/e (ESI) 484.4 (MH⁺)

実施例 1470

(1-{3-第 3 プチル-5-[2-(5-エトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシフェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸;
臭化水素酸塩

20 MS:m/e (ESI) 528.3 (MH⁺)

実施例 1471

({3-第 3 プチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシベンジル}-メトキシカルボニル-アミノ)-酢酸;
臭化水素酸塩

25 MS:m/e (ESI) 569.5 (MH⁺)

実施例 1472

({3-第3ブチル-5-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-
ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシベンジル}-メトキ
シカルボニル-アミノ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 568.5(MH⁺)

5 実施例 1473

({3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシベンジル}-メトキシカルボニル
-アミノ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 574.4(MH⁺)

10 実施例 1474

({3-第3ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシベンジル}-メトキシカルボニル
-アミノ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 546.3(MH⁺)

15 実施例 1475

({3-第3ブチル-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジ
ン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシベンジル}-メタンスルフォニル-アミノ)-
酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 517.3(MH⁺)

20 実施例 1476

({3-第3ブチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒド
ロ-イソオンドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシベンジル}-メタンスルフ
オニル-アミノ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 589.4(MH⁺)

25 実施例 1477

({3-第3ブチル-5-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-

ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシベンジル}-メタン

スルフォニル-アミノ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 588. 4(MH⁺)

実施例 1478

5 {3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシベンジル}-メタンスルフォニル-アミノ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 594. 5(MH⁺)

実施例 1479

10 {3-第3ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシベンジル}-メタンスルフォニル-アミノ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 566. 4(MH⁺)

実施例 1480

15 {2-第3ブチル-6-(3-カルバモイル-プロポキシ)-4-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 511. 4(MH⁺)

実施例 1481

20 {2-第3ブチル-6-(3-カルバモイル-プロポキシ)-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 583. 5(MH⁺)

実施例 1482

25 {2-第3ブチル-6-(3-カルバモイル-プロポキシ)-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-

酢酸;臭化水素酸塩MS:m/e (ESI) 588. 5 (MH⁺)

実施例 1483

(1-{3-第 3 プチル-2-ヒドロキシ-5-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロ5 ロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸;臭化水素酸塩MS:m/e (ESI) 481. 4 (MH⁺)

実施例 1484

{2-第 3 プチル-6-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-4-[2-(7-イミノ-2-メチル10 -5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩MS:m/e (ESI) 481. 4 (MH⁺)

実施例 1485

{2-第 3 プチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロ15 ロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩MS:m/e (ESI) 439. 4 (MH⁺)

実施例 1486

(1-{3-第 3 プチル-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシフェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-20 酢酸;臭化水素酸塩MS:m/e (ESI) 495. 3 (MH⁺)

実施例 1487

[2-第 3 プチル-4-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;25 臭化水素酸塩MS:m/e (ESI) 495. 4 (MH⁺)

実施例 1488

{2-第3ブチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(2-エチル-7-イミノ-4,4a,5,7-テトラヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

5 MS:m/e(ESI) 453.4(MH⁺)

実施例 1489

4-{2-第3ブチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブタシン酸;臭化水素酸塩

10 MS:m/e(ESI) 553.2(MH⁺)

実施例 1490

6-{2-第3ブチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ヘキサン酸;臭化水素酸塩

15 MS:m/e(ESI) 581.5(MH⁺)

実施例 1491

{2-(4-アセチルアミノ-ブトキシ)-6-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

20 MS:m/e(ESI) 611.5(MH⁺)

実施例 1492

4-{2-アセチルアミノ-6-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブタシン酸;臭化水素酸塩

25 MS:m/e(ESI) 567.5(MH⁺)

実施例 1493

6-エトキシ-3-イミノ-2-[2-(8-イソプロピル-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル)-2-オキソ-エチル]-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 465. 4 (MH⁺)

5 実施例 1494

{6-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-8-イソプロピル-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 509. 3 (MH⁺)

10 実施例 1495

4-{6-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-4,4-ジメチル-2-オキソ-3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 535. 4 (MH⁺)

15 実施例 1496

4-{2-第3ブチル-4-[2-(6-カルバモイル-5-エトキシ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ジメチルアミノ-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 539. 3 (MH⁺)

20 実施例 1497

6-{2-第3ブチル-4-[2-(6-カルバモイル-5-エトキシ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ジメチルアミノ-フェノキシ}-ヘキサン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 567. 5 (MH⁺)

25 実施例 1498

4-{2-第3ブチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(5-エトキシ-4-フルオロ-1-イミノ-6-

メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 571. 3 (MH^+)

実施例 1499

5 6-{2-第3ブチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(5-エトキシ-4-フルオロ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ヘキサン酸;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 599. 5 (MH^+)

実施例 1500

10 (1-{3-第3ブチル-5-[2-(5-エトキシ-4-フルオロ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシフェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 585. 5 (MH^+)

実施例 1501

15 4-{6-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-4, 4-ジメチル-2-オキソ-3, 4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 534. 4 (MH^+)

実施例 1502

20 4-{2-第3ブチル-4-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ジメチルアミノ-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 558. 4 (MH^+)

実施例 1503

25 6-{2-第3ブチル-4-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ジメチルアミノ-フェノキシ}-ヘキサン酸;

臭化水素酸塩MS:m/e (ESI) 586. 5 (MH⁺)

実施例 1504

{2-(4-アセチルアミノ-ブトキシ)-6-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 616. 5 (MH⁺)

実施例 1505

4-{2-アセチルアミノ-6-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 572. 5 (MH⁺)

実施例 1506

2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-1-(8-イソプロピル-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 470. 4 (MH⁺)

実施例 1507

{6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-8-イソプロピル-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 514. 3 (MH⁺)

実施例 1508

(4-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-ベンジル}-ピペラジン-1-イル)-酢酸 エチル エステル;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 597. 5 (MH⁺)

実施例 1509

4-[6-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-4, 4-ジメチル-2-オキソ-3, 4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イ
ル]-ブタン酸; 臭化水素酸塩

5 MS: m/e (ESI) 540. 4 (MH⁺)

実施例 1510

4-[2-第 3 ブチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキ
シ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ]-ブタン酸; 臭
10 化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 530. 4 (MH⁺)

実施例 1511

6-[2-第 3 ブチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキ
シ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ]-ヘキサン酸;

15 臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 558. 5 (MH⁺)

実施例 1512

{2-(4-アセチルアミノ-ブトキシ)-6-第 3 ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキ
シ}-酢酸; 臭化水素酸塩

20 MS: m/e (ESI) 588. 5 (MH⁺)

実施例 1513

4-[2-アセチルアミノ-6-第 3 ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキ
シ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ]-ブタン酸; 臭
25 化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 544. 4 (MH⁺)

実施例 1514

2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-1-(8-イソプロピル-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 442. 4 (MH⁺)

実施例 1515

{6-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-8-イソプロピル-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

10 MS:m/e (ESI) 486. 3 (MH⁺)

実施例 1516

(4-{3-第3ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-ベンジル}-ピペラジン-1-イル)-酢酸 エチル エステル;臭化水素酸塩

15 MS:m/e (ESI) 569. 5 (MH⁺)

実施例 1517

4-{6-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-4,4-ジメチル-2-オキソ-3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル}-ブタン酸;臭化水素酸塩

20 MS:m/e (ESI) 512. 4 (MH⁺)

実施例 1518

{2-(4-アセチルアミノ-ブトキシ)-6-第3ブチル-4-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

25 MS:m/e (ESI) 539. 5 (MH⁺)

実施例 1519

4-{2-アセチルアミノ-6-第3ブチル-4-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩
 MS:m/e(ESI) 495.4(MH+)

実施例 1520

5 2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-1-(8-イソプロピル-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 393.4(MH+)

実施例 1521

10 {6-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-8-イソプロピル-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 437.3(MH+)

実施例 1522

15 (4-{3-第3ブチル-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-ベンジル}-ピペラジン-1-イル)-酢酸 エチル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 520.5(MH+)

実施例 1523

20 4-{6-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-4,4-ジメチル-2-オキソ-3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 463.4(MH+)

実施例 1524

25 {2-(4-アセチルアミノ-ブトキシ)-6-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢

酸;臭化水素酸塩MS:m/e(ESI) 551.5(MH⁺)

実施例 1525

4-[2-アセチルアミノ-6-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ]-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 507.4(MH⁺)

実施例 1526

2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-1-(8-イソプロピル-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 405.4(MH⁺)

実施例 1527

{6-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-8-イソプロピル-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 449.3(MH⁺)

実施例 1528

(4-{3-第3ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-ベンジル}-ピペラジン-1-イル)-酢酸 エチル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 532.5(MH⁺)

実施例 1529

4-{6-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-4,4-ジメチル-2-オキソ-3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 475.4 (MH⁺)

実施例 1530

[4-(3-第3ブチル-5-{2-[5-エトキシ-1-イミノ-6-(1-メトキシ-プロピル)-1,3-

ジヒドロ-イソインドール-2-イル]-アセチル}-ベンジル)-ピペラジン-1-イル]-

5 酢酸 エチル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 607.6 (MH⁺)

実施例 1531

(2-第3ブチル-6-ジメチルアミノ-4-{2-[5-エトキシ-1-イミノ-6-(1-メトキシ-

プロピル)-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル]-アセチル}-フェノキシ)-酢

10 酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 540.4 (MH⁺)

実施例 1532

(4-{3-第3ブチル-5-[2-(6-第3ブチル-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-

-2-イル)-アセチル}-ベンジル)-ピペラジン-1-イル)-酢酸 エチル エステル;臭

15 化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 547.2 (MH⁺)

実施例 1533

{2-第3ブチル-4-[2-(6-第3ブチル-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-

-イル)-アセチル]-6-ジメチルアミノ-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

20 MS:m/e(ESI) 480.4 (MH⁺)

実施例 1534

{2-(4-アセチルアミノ-ブトキシ)-6-第3ブチル-4-[2-(6-第3ブチル-1-イミノ-

-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水素

酸塩

25 MS:m/e(ESI) 566.5 (MH⁺)

実施例 1535

{2-第3ブチル-4-[2-(6-第3ブチル-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 506.5(MH⁺)

実施例 1536

5 4-{3-第3ブチル-5-[2-(6-第3ブチル-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェノキシ}-ブチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 494.5(MH⁺)

実施例 1537

10 4-{3-第3ブチル-5-[2-(6-第3ブチル-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェノキシ}-ブチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 480.5(MH⁺)

実施例 1538

4-{2-第3ブチル-4-[2-(6-第3ブチル-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-メトキシ-フェノキシ}-ブチルアミド;臭化水素酸塩

15 MS:m/e(ESI) 494.3(MH⁺)

実施例 1539

{2-第3ブチル-4-[2-(6-第3ブチル-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-モルフォリン-4-イル-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 522.3(MH⁺)

20 実施例 1540

4-{3-第3ブチル-2-ヒドロキシ-5-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 439.4(MH⁺)

実施例 1541

25 {2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イルメチル-フェノキシ}-酢酸;臭

化水素酸塩MS: m/e (ESI) 505. 1(MH⁺)

実施例 1542

1-{3-第 3 プチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ
 5 [3,4-b] ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル}-ピロリジン-3-カル
 ボン酸;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 491. 2(MH⁺)

実施例 1543

4-{2-アセチルアミノ-6-第 3 プチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジ
 10 ヒドロ-ピロロ [3,4-b] ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブチルアミド;
 臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 506. 2(MH⁺)

実施例 1544

5-{2-アセチルアミノ-6-第 3 プチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジ
 15 ヒドロ-ピロロ [3,4-b] ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭
 化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 521. 3(MH⁺)

実施例 1545

1-{3-第 3 プチル-4-ヒドロキシ-5-[3-(2-メトキシエトキシ)-プロポキシ]-フェ
 20 ニル}-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ [3,4-b] ピリジン-6-
 イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 496. 3(MH⁺)

実施例 1546

4-{3-第 3 プチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ
 25 [3,4-b] ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシフェノキシ}-ブチロニチリ
 ル;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 447. 3 (MH^+)

実施例 1547

3-{7-第 3 プチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-ベンゾオキサゾール-2-イル}-プロピオン

5 酸;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 461. 3 (MH^+)

実施例 1548

{2-第 3 プチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イルメチルフェノキ

10 シ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 565. 4 (MH^+)

実施例 1549

1-{3-第 3 プチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル}-ピロリジン-3-

15 カルボン酸;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 551. 3 (MH^+)

実施例 1550

2-{2-[3-アセチルアミノ-5-第 3 プチル-4-(3-カルバモイル-プロポキシ)-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール

20 -5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 566. 4 (MH^+)

実施例 1551

5-{2-アセチルアミノ-6-第 3 プチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペン

25 タン酸;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 581. 4 (MH^+)

実施例 1552

{2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソイソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イルメチルフェノキシ}-酢酸；臭化水素酸塩

5 MS:m/e(ESI) 570.4(MH⁺)

実施例 1553

1-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソイソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル}-ピロリジン-3-カルボン酸；臭化水素酸塩

10 MS:m/e(ESI) 556.3(MH⁺)

実施例 1554

1-{3-第3ブチル-4-ヒドロキシ-5-[3-(2-メトキシエトキシ)-プロポキシ]-フェニル}-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン；臭化水素酸塩

15 MS:m/e(ESI) 561.4(MH⁺)

実施例 1555

4-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソイソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシフェノキシ}-ブチロニチリル；臭化水素酸塩

20 MS:m/e(ESI) 512.3(MH⁺)

実施例 1556

3-{7-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソイソインドール-2-イル)-アセチル]-ベンゾオキサゾール-2-イル}-プロピオン酸；臭化水素酸塩

25 MS:m/e(ESI) 526.3(MH⁺)

実施例 1557

4-{2-アセチルアミノ-6-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 543.3 (MH⁺)

5 実施例 1558

5-{2-アセチルアミノ-6-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 558.4 (MH⁺)

10 実施例 1559

(1-{5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシフェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 451.3 (MH⁺)

15 実施例 1560

(1-{5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシフェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 511.4 (MH⁺)

20 実施例 1561

(1-{5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシフェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 488.3 (MH⁺)

25 実施例 1562

(1-{3-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソイン

ドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸;臭化水

素酸塩

MS:m/e (ESI) 495. 4 (MH⁺)

実施例 1563

5 {4-第 3 プチル-6-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-ベンゾイミダゾール-1-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 506. 4 (MH⁺)

実施例 1564

10 {4-第 3 プチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-ベンゾイミダゾール-1-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 511. 3 (MH⁺)

実施例 1565

15 [4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 451. 2 (MH⁺)

実施例 1566

20 [4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 511. 3 (MH⁺)

実施例 1567

25 [4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;臭化

水素酸塩

MS:m/e (ESI) 488. 3 (MH+)

実施例 1568

1-[3-第 3 プチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル]-ピロリジン-2-イル)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 505. 4 (MH+)

実施例 1569

1-(7-第 3 プチル-3-メチル-3H-ベンズイミダゾール-5-イル)-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 402. 3 (MH+)

実施例 1570

1-(7-第 3 プチル-3H-ベンズイミダゾール-5-イル)-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 388. 3 (MH+)

実施例 1571

1-[3-第 3 プチル-4-ヒドロキシ-5-(4-ヒドロキシ-ブトキシ)-フェニル]-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 452. 4 (MH+)

実施例 1572

[2-第 3 プチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(4-ヒドロキシ-ブトキシ)-フェノキシ]-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 510. 4 (MH+)

実施例 1573

1-(3-第3ブチルフェニル)-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロ
ロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 348. 4(MH+)

5 実施例 1574

(1-{3-第3ブチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒ
ドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル}-ピロリジン-2-
イル)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 565. 4(MH+)

10 実施例 1575

2-[2-(7-第3ブチル-3-メチル-3H-ベンズイミダゾール-5-イル)-2-オキソ-エチ
ル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミ
ド;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 462. 4(MH+)

15 実施例 1576

2-[2-(7-第3ブチル-3H-ベンズイミダゾール-5-イル)-2-オキソ-エチル]-6-エト
キシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素
酸塩

MS:m/e(ESI) 448. 0(MH+)

20 実施例 1577

2-{2-[3-第3ブチル-4-ヒドロキシ-5-(4-ヒドロキシ-ブトキシ)-フェニル]-2-オ
キソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メ
チルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 512. 2(MH+)

25 実施例 1578

[2-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒド

ロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(4-ヒドロキシ-ブトキシ)-フェノキシ]-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 570. 3 (MH+)

実施例 1579

5 2-{2-[3-第3ブチル-4-ヒドロキシ-5-(4-ヒドロキシ-ブトキシ)-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 511. 3 (MH+)

実施例 1580

10 [2-第3ブチル-4-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(4-ヒドロキシ-ブトキシ)-フェノキシ]-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 569. 3 (MH+)

実施例 1581

15 (1-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピロリジン-2-イル)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 570. 3 (MH+)

実施例 1582

20 1-(7-第3ブチル-3-メチル-3H-ベンズイミダゾール-5-イル)-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 467. 3 (MH+)

実施例 1583

25 1-(7-第3ブチル-3H-ベンズイミダゾール-5-イル)-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 453. 3 (MH⁺)

実施例 1584

1-[3-第3ブチル-4-ヒドロキシ-5-(4-ヒドロキシ-ブトキシ)-フェニル]-2-(5,6-
ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタ

5 ノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 517. 4 (MH⁺)

実施例 1585

[2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソ
インドール-2-イル)-アセチル]-6-(4-ヒドロキシ-ブトキシ)-フェノキシ]-酢酸;

10 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 575. 4 (MH⁺)

実施例 1586

1-(3-第3ブチル-フェニル)-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒ
ドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

15 MS:m/e (ESI) 413. 4 (MH⁺)

実施例 1587

1-[3-第3ブチル-4-ヒドロキシ-5-(4-ヒドロキシ-ブトキシ)-フェニル]-2-(7-フ
ルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタ
ノン;臭化水素酸塩

20 MS:m/e (ESI) 489. 4 (MH⁺)

実施例 1588

[2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソ
インドール-2-イル)-アセチル]-6-(4-ヒドロキシ-ブトキシ)-フェノキシ]-酢酸;
臭化水素酸塩

25 MS:m/e (ESI) 547. 4 (MH⁺)

実施例 1589

5-[2-第3ブチル-4-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イルフェノキシ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 507. 5 (MH⁺)

5 実施例 1590

1-(7-第3ブチル-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 389. 3 (MH⁺)

実施例 1591

10 4-{2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブチロニチリル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 431. 3 (MH⁺)

実施例 1592

15 (1-{5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-3-エチル-2-ヒドロキシフェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 479. 3 (MH⁺)

実施例 1593

20 (1-{5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-3-イソプロピルフェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 493. 3 (MH⁺)

実施例 1594

25 [2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(3-メトキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-

酢酸;臭化水素酸塩MS:m/e(ESI) 521. 4(MH⁺)

実施例 1595

[2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]5 ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(3-エトキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;臭化水素酸塩MS:m/e(ESI) 535. 4(MH⁺)

実施例 1596

1-(7-第3ブチル-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ10 -1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩MS:m/e(ESI) 454. 3(MH⁺)

実施例 1597

4-{2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブチロニチリル;臭化水素酸塩15 MS:m/e(ESI) 496. 4(MH⁺)

実施例 1598

(1-{5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-3-エチル-2-ヒドロキシフェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸;臭化水素酸塩20 MS:m/e(ESI) 544. 4(MH⁺)

実施例 1599

(1-{5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-3-イソプロピルフェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸;臭化水素酸塩25 MS:m/e(ESI) 558. 4(MH⁺)

実施例 1600

[2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソ
インドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-メトキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキ
シ]-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 586. 4 (MH⁺)

5 実施例 1601

[2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソ
インドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-エトキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキ
シ]-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 600. 5 (MH⁺)

10 実施例 1602

(1-{5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソイン
ドール-2-イル)-アセチル]-3-エチル-2-ヒドロキシフェニル}-ピロリジン-3-イ
ルオキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 539. 4 (MH⁺)

15 実施例 1603

(1-{5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソイン
ドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-3-イソプロピルフェニル}-ピロリジ
ン-3-イルオキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 553. 4 (MH⁺)

20 実施例 1604

[2-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒド
ロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-エトキシ-ピロリジン-1-イル)-フ
ェノキシ]-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 595. 5 (MH⁺)

25 実施例 1605

[2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソ

インドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-メトキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 558. 4 (MH⁺)

実施例 1606

5 {2-第3ブチル-6-(3-エトキシ-ピロリジン-1-イル)-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 572. 4 (MH⁺)

実施例 1607

10 4-(3-第3ブチル-5-{2-[5-(4-ヒドロキシ-3,5-ジメトキシフェニル)-2-イミノ-thiazol-3-イル]-アセチル}-2-メトキシフェノキシ)-ブチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 558. 3 (MH⁺)

実施例 1608

15 6-{2-[3-第3ブチル-5-(3-カルバモイル-プロポキシ)-4-メトキシフェニル]-2-オキソ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 540. 2 (MH⁺)

実施例 1609

20 {2-第3ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 565. 1 (MH⁺)

実施例 1610

25 5-{2-第3ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキ

シ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩MS:m/e (ESI) 607. 4 (MH⁺)

実施例 1611

(3-{3-第3ブチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシフェノキシ}-ピロリジン-1-イル)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 567. 4 (MH⁺)

実施例 1612

{1-アセチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-3,3-ジメチル-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-2-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 521. 3 (MH⁺)

実施例 1613

2-{2-[3-第3ブチル-4-(3-シアノ-プロポキシ)-5-(2-オキソ-ピペリジン-1-イルメチル)-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 602. 3 (MH⁺)

実施例 1614

{2-第3ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 570. 2 (MH⁺)

実施例 1615

(3-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシフェノキシ}-ピロリジン-1-イル)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 572. 4 (MH+)

実施例 1616

{1-アセチル-5-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソイ
ンドール-2-イル)-アセチル]-3, 3-ジメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インドール-2-イ
ル}-酢酸; 臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 526. 3 (MH+)

実施例 1617

4-[2-第3ブチル-4-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(2-オキソ-ピペリジン-1-イルメチル)-フェ
ノキシ]-ブチロニチリル; 臭化水素酸塩

10 MS:m/e (ESI) 607. 5 (MH+)

実施例 1618

{2-第3ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ
-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;

15 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 505. 4 (MH+)

実施例 1619

(3-{3-第3ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ
[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシフェノキシ}-ピロリジン-1-
イル}-酢酸; 臭化水素酸塩

20 MS:m/e (ESI) 507. 4 (MH+)

実施例 1620

{1-アセチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピ
リジン-6-イル)-アセチル]-3, 3-ジメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インドール-2-イ
ル}-酢酸; 臭化水素酸塩

25 MS:m/e (ESI) 461. 3 (MH+)

実施例 1621

4-[2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(2-オキソ-ピペリジン-1-イルメチル)-フェノキシ]-ブチロニチリル;臭化水素酸塩

5 MS:m/e(ESI) 542. 4(MH+)

実施例 1622

{2-第 3 ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

10 MS:m/e(ESI) 542. 2(MH+)

実施例 1623

5-{2-第 3 ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

15 MS:m/e(ESI) 584. 4(MH+)

実施例 1624

(3-{3-第 3 ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシフェノキシ}-ピロリジン-1-イル)-酢酸;臭化水素酸塩

20 MS:m/e(ESI) 544. 4(MH+)

実施例 1625

4-[2-第 3 ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(2-オキソ-ピペリジン-1-イルメチル)-フェノキシ]-ブチロニチリル;臭化水素酸塩

25 MS:m/e(ESI) 579. 4(MH+)

実施例 1626

4-[2-第3ブチル-4-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(2-オキソ-ピペリジン-1-イルメチル)-フェノキシ]-ブチロニチリル;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 516.4(MH⁺)

5 実施例 1627

{2-第3ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 566.3(MH⁺)

10 実施例 1628

5-{2-第3ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 608.4(MH⁺)

15 実施例 1629

4-{2-第3ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 580.4(MH⁺)

20 実施例 1630

5-{2-第3ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 594.5(MH⁺)

25 実施例 1631

4-{2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ

[3, 4-b] ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-メタンスルフォニルアミノ-フェノキシ}-ブチルアミド; 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 542. 3 (MH⁺)

実施例 1632

5 (1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b] ピリジン-6-イル)-アセチル]-ベンジル}-ピペリジン-4-イルオキシ)-酢酸; 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 519. 3 (MH⁺)

実施例 1633

10 1-(3-第 3 ブチル-5-ジメチルアミノ-フェニル)-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b] ピリジン-6-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 391. 3 (MH⁺)

実施例 1634

15 5-{2-第 3 ブチル-6-(3-シアノプロポキシ)-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b] ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタノ酸; 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 547. 3 (MH⁺)

実施例 1635

20 2-{2-[3-第 3 ブチル-4-(3-カルバモイル-プロポキシ)-5-メタンスルフォニルアミノ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-インドール-5-酢酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 602. 4 (MH⁺)

実施例 1636

25 (1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-ベンジル}-ピペリジン-4-イルオキシ)-酢酸; 臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 579. 4(MH⁺)

実施例 1637

4-(2-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル)-メチルアミノ)-ブタン酸;

5 臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 523. 4(MH⁺)

実施例 1638

4-(2-第3ブチル-4-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル)-メチルアミノ)-

10 ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 522. 4(MH⁺)

実施例 1639

4-{2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-メタノスルフォニルアミノ-フェノキシ}-ブ

15 チルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 579. 4(MH⁺)

実施例 1640

(1-{3-第3ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-ベンジル}-ピペリジン-4-イルオキシ)-酢

20 酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 556. 4(MH⁺)

実施例 1641

1-(3-第3ブチル-5-ジメチルアミノ-フェニル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

25 MS:m/e(ESI) 428. 4(MH⁺)

実施例 1642

4-[2-第 3 プチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(3-メトキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 549. 4 (MH⁺)

5 実施例 1643

5-[2-第 3 プチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(3-メトキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 563. 4 (MH⁺)

10 実施例 1644

4-[2-第 3 プチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(3-エトキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 563. 4 (MH⁺)

15 実施例 1645

4-[2-第 3 プチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-メトキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 609. 5 (MH⁺)

20 実施例 1646

5-[2-第 3 プチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-メトキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 623. 5 (MH⁺)

25 実施例 1647

4-[2-第 3 プチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒ

ドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-エトキシ-ピロリジン-1-イル)-
フェノキシ]-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 623. 5 (MH+)

実施例 1648

5 5-[2-第 3 プチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒ
ドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-エトキシ-ピロリジン-1-イル)-
フェノキシ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 637. 6 (MH+)

実施例 1649

10 4-[2-第 3 プチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒ ドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-メトキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキ
シ]-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 586. 5 (MH+)

実施例 1650

15 5-[2-第 3 プチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒ ドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-メトキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキ
シ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 600. 5 (MH+)

実施例 1651

20 4-{2-第 3 プチル-6-(3-エトキシ-ピロリジン-1-イル)-4-[2-(7-フルオロ-1-イミ
ノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒ ドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキ
シ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 600. 5 (MH+)

実施例 1652

25 5-{2-第 3 プチル-6-(3-エトキシ-ピロリジン-1-イル)-4-[2-(7-フルオロ-1-イミ
ノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒ ドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキ

シ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 614. 5 (MH+)

実施例 1653

2-[2-[3-第3ブチル-4-(2,5-ジオキソ-ピロリジン-1-イル)-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 505. 3 (MH+)

実施例 1654

1-{2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-1イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-ピロリジン-2,5-ジオン;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 482. 3 (MH+)

実施例 1655

6-[2-[3-第3ブチル-4-(2,5-ジオキソ-ピロリジン-1-イル)-フェニル]-2-オキソ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 506. 3 (MH+)

実施例 1656

1-{2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル}-ピロリジン-2,5-ジオン;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 445. 3 (MH+)

実施例 1657

4-{2-第3ブチル-6-ジエチルアミノ-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブタノ酸;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 581. 5 (MH^+)

実施例 1658

4-{2-第 3 プチル-6-ジエチルアミノ-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブタン酸; 臭化水素酸塩

5 MS: m/e (ESI) 558. 4 (MH^+)

実施例 1659

4-{2-第 3 プチル-6-ジエチルアミノ-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブタン酸; 臭化水素酸塩

10 MS: m/e (ESI) 582. 5 (MH^+)

実施例 1660

4-{2-第 3 プチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ジエチルアミノ-フェノキシ}-ブタン酸; 臭化水素酸塩

15 MS: m/e (ESI) 521. 5 (MH^+)

実施例 1661

4-{2-第 3 プチル-6-ジエチルアミノ-4-[2-(7-イミノ-2-メチル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブタン酸; 臭化水素酸塩

20 MS: m/e (ESI) 495. 4 (MH^+)

実施例 1662

5-{2-第 3 プチル-6-ジエチルアミノ-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸; 臭化水素酸塩

25 MS: m/e (ESI) 595. 5 (MH^+)

実施例 1663

5-[2-第3ブチル-6-ジエチルアミノ-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ]-ペンタン酸；臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 572.5(MH⁺)

5 実施例 1664

5-[2-第3ブチル-6-ジエチルアミノ-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ]-ペンタン酸；臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 596.5(MH⁺)

10 実施例 1665

5-[2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ジエチルアミノ-フェノキシ]-ペンタン酸；臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 535.5(MH⁺)

15 実施例 1666

5-[2-第3ブチル-6-ジエチルアミノ-4-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ]-ペンタン酸；臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 509.4(MH⁺)

20 実施例 1667

2-[2-[3-第3ブチル-5-(メタンスルフォニル-メチル-アミノ)-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド；臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 515.4(MH⁺)

25 実施例 1668

N-[3-第3ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イ

ソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-N-メチル-メタンスルフォンアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 492. 3 (MH⁺)

実施例 1669

5 N-{3-第 3 ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル}-N-メチル-メタンスルフォンアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 455. 3 (MH⁺)

実施例 1670

10 (1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(1-イミノ-5-メトキシ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 567. 4 (MH⁺)

実施例 1671

15 (1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 558. 4 (MH⁺)

実施例 1672

20 4-{2-第 3 ブチル-6-(3-シアノ-ピロリジン-1-イル)-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 544. 2 (MH⁺)

実施例 1673

25 5-{2-第 3 ブチル-6-(3-シアノ-ピロリジン-1-イル)-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-

ペンタン酸;臭化水素酸塩MS: m/e (ESI) 558. 2 (MH^+)

実施例 1674

4-{2-第3ブチル-6-(3-シアノ-ピロリジン-1-イル)-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩MS: m/e (ESI) 604. 3 (MH^+)

実施例 1675

5-{2-第3ブチル-6-(3-シアノ-ピロリジン-1-イル)-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩MS: m/e (ESI) 618. 3 (MH^+)

実施例 1676

4-{2-第3ブチル-6-(3-シアノ-ピロリジン-1-イル)-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩MS: m/e (ESI) 581. 2 (MH^+)

実施例 1677

5-{2-第3ブチル-6-(3-シアノ-ピロリジン-1-イル)-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩MS: m/e (ESI) 595. 2 (MH^+)

実施例 1678

5-{2-第3ブチル-6-(3-カルバモイル-ピロリジン-1-イル)-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 576. 3 (MH^+)

実施例 1679

4-[2-第3ブチル-6-(3-カルバモイル-ピロリジン-1-イル)-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

5

MS: m/e (ESI) 622. 3 (MH^+)

実施例 1680

5-[2-第3ブチル-6-(3-カルバモイル-ピロリジン-1-イル)-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

10

MS: m/e (ESI) 636. 3 (MH^+)

実施例 1681

4-[2-第3ブチル-6-(3-カルバモイル-ピロリジン-1-イル)-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

15

MS: m/e (ESI) 599. 2 (MH^+)

実施例 1682

5-[2-第3ブチル-6-(3-カルバモイル-ピロリジン-1-イル)-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

20

MS: m/e (ESI) 613. 3 (MH^+)

実施例 1683

4-[2-第3ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブチロニチリル;臭化水素酸塩

25

MS: m/e (ESI) 514. 2 (MH^+)

実施例 1684

5-[4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ピロリジン-1-イル-フェノキシ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩
MS:m/e(ESI) 477. 2 (MH⁺)

5 実施例 1685

6-{2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ヘキサン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 547. 3 (MH⁺)

10 実施例 1686

4-{2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ジメチルアミノ-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 493. 3 (MH⁺)

15 実施例 1687

5-{2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ジメチルアミノ-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 507. 3 (MH⁺)

20 実施例 1688

4-[2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(メチル-プロピル-アミノ)-フェノキシ]-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 521. 3 (MH⁺)

25 実施例 1689

5-[2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(メチル-プロピル-アミノ)-フェノキシ]-ブタン酸;臭化水素酸塩

[3, 4-b] ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(メチル-プロピル-アミノ)-フェノキシ]-ペンタン酸; 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 535. 4 (MH+)

実施例 1690

5 6-[2-[3-第 3 ブチル-4, 5-ビス-(3-シアノ-プロポキシ)-フェニル]-2-オキソ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6, 7-ジヒドロ-5H-ピロロ [3, 4-b] ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 575. 3 (MH+)

実施例 1691

10 5-[4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ [3, 4-b] ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ピロリジン-1-イル-フェノキシ]-ペンタン酸; 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 538. 3 (MH+)

実施例 1692

15 6-[2-第 3 ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ [3, 4-b] ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ]-ヘキサン酸; 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 608. 4 (MH+)

実施例 1693

20 4-[2-第 3 ブチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ [3, 4-b] ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ]-ブタン酸; 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 554. 3 (MH+)

実施例 1694

25 5-[2-第 3 ブチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ [3, 4-b] ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ]

シ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩MS:m/e (ESI) 568. 4 (MH⁺)

実施例 1695

4-[2-第 3 ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(メチル-プロピル-アミノ)-フェノキシ]-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 582. 4 (MH⁺)

実施例 1696

5-[2-第 3 ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(メチル-プロピル-アミノ)-フェノキシ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 596. 4 (MH⁺)

実施例 1697

4-{2-第 3 ブチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 467. 3 (MH⁺)

実施例 1698

5-{2-第 3 ブチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸

20 塩

MS:m/e (ESI) 481. 3 (MH⁺)

実施例 1699

4-[2-第 3 ブチル-4-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(メチル-プロピル-アミノ)-フェノキシ]-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 495. 3 (MH⁺)

実施例 1700

5-[2-第3ブチル-4-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(メチル-プロピル-アミノ)-フェノキシ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 509.4 (MH⁺)

実施例 1701

4-{2-第3ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブチロニチリル;臭化水素酸塩

10 MS:m/e (ESI) 551.3 (MH⁺)

実施例 1702

5-{4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

15 MS:m/e (ESI) 514.3 (MH⁺)

実施例 1703

6-{2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ヘキサン酸;臭化水素酸塩

20 MS:m/e (ESI) 584.3 (MH⁺)

実施例 1704

4-{2-第3ブチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

25 MS:m/e (ESI) 530.3 (MH⁺)

実施例 1705

5-{2-第 3 プチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 544. 3 (MH⁺)

5 実施例 1706

4-[2-第 3 プチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(メチル-プロピル-アミノ)-フェノキシ]-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 558. 3 (MH⁺)

10 実施例 1707

5-[2-第 3 プチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(メチル-プロピル-アミノ)-フェノキシ]-ペニタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 572. 3 (MH⁺)

15 実施例 1708

4-{2-第 3 プチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブチロニチリル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 579. 3 (MH⁺)

20 実施例 1709

5-{4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 542. 3 (MH⁺)

25 実施例 1710

2-{2-[3-第 3 プチル-4,5-ビス-(3-シアノ-プロポキシ)-フェニル]-2-オキソ-エ

チル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルア

ミド;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 574. 4(MH⁺)

実施例 1711

5 5-{4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソイン
ドール-2-イル)-アセチル]-2-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化
水素酸塩

MS:m/e(ESI) 537. 3(MH⁺)

実施例 1712

10 6-{2-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒ
ドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ヘ
キサン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 607. 4(MH⁺)

実施例 1713

15 4-{2-第3ブチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカル
バモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブタ
ン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 553. 4(MH⁺)

実施例 1714

20 5-{2-第3ブチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカル
バモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペン
タン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 567. 4(MH⁺)

実施例 1715

25 4-[2-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒ
ドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(メチル-プロピル-アミノ)-フェノ

キシ]-ブタン酸;臭化水素酸塩MS:m/e(ESI) 581. 4(MH⁺)

実施例 1716

5-[2-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(メチル-プロピル-アミノ)-フェニルキシ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 595. 4(MH⁺)

実施例 1717

1-(3,5-ジヒドロ-第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-(2-ヒドロキシメチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 410. 3(MH⁺)

実施例 1718

{2-第3ブチル-4-[2-(2-ヒドロキシメチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-酢酸;

臭化水素酸塩MS:m/e(ESI) 481. 3(MH⁺)

実施例 1719

5-{2-第3ブチル-4-[2-(2-ヒドロキシメチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ペント

ン酸;臭化水素酸塩MS:m/e(ESI) 523. 4(MH⁺)

実施例 1720

{2-第3ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[2-(2-ヒドロキシメチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;

臭化水素酸塩MS:m/e(ESI) 495. 3(MH⁺)

実施例 1721

5-{2-第 3 プチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[2-(2-ヒドロキシメチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペン
タン酸;臭化水素酸塩

5 MS:_{m/e}(ESI) 537. 3(MH⁺)

実施例 1722

1-(3,5-ジ-第 3 プチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-(2-フルオロメチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:_{m/e}(ESI) 412. 3(MH⁺)

実施例 1723

{2-第 3 プチル-4-[2-(2-フルオロメチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:_{m/e}(ESI) 483. 3(MH⁺)

実施例 1724

5-{2-第 3 プチル-4-[2-(2-フルオロメチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ペンタ
ン酸;臭化水素酸塩

MS:_{m/e}(ESI) 525. 4(MH⁺)

実施例 1725

{2-第 3 プチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[2-(2-フルオロメチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;
臭化水素酸塩

MS:_{m/e}(ESI) 497. 3(MH⁺)

実施例 1726

5-{2-第 3 プチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[2-(2-フルオロメチル-7-イミノ-

-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタ
ン酸;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 539. 3 (MH⁺)

実施例 1727

5 5-{2-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒ
ドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ペント-4-エニルオキシ-フェノキ
シ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 608. 4 (MH⁺)

実施例 1728

10 5-{2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ペント-4-エニルオキシ-フェノキシ}-ペン
タン酸;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 585. 4 (MH⁺)

実施例 1729

15 5-{2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ
[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ペント-4-エニルオキシ-フェノキシ}-ペ
ンタン酸;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 548. 4 (MH⁺)

実施例 1730

20 5-{2-第3ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒ
ドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ペント-4-エニルオキシ-フ
ェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 609. 4 (MH⁺)

実施例 1731

25 4-[2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ
[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(3-フルオロ-ピロリジン-1-イル)-フエ

ノキシ]-ブタン酸;臭化水素酸塩MS:m/e(ESI) 537. 2 (MH⁺)

実施例 1732

5-[2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピロリジン-6-イル)-アセチル]-6-(3-フルオロ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩MS:m/e(ESI) 551. 3 (MH⁺)

実施例 1733

4-[2-第 3 ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-フルオロ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-ブタン酸;臭化水素酸塩MS:m/e(ESI) 597. 3 (MH⁺)

実施例 1734

5-[2-第 3 ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-フルオロ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩MS:m/e(ESI) 611. 3 (MH⁺)

実施例 1735

4-[2-第 3 ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-フルオロ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-ブタン酸;臭化水素酸塩MS:m/e(ESI) 574. 3 (MH⁺)

実施例 1736

5-[2-第 3 ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-フルオロ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 588. 3 (MH^+)

実施例 1737

4-[2-第 3 プチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(4-オキソ-ピペリジン-1-イル)-フェノキシ]-ブタン酸 エチル エステル;臭化水素酸塩

5

MS: m/e (ESI) 635. 2 (MH^+)

実施例 1738

4-[2-第 3 プチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(4-オキソ-ピペリジン-1-イル)-フェノキシ]-ブタン酸 エチル エステル;臭化水素酸塩

10

MS: m/e (ESI) 612. 4 (MH^+)

実施例 1739

4-[2-第 3 プチル-4-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(4-オキソ-ピペリジン-1-イル)-フェノキシ]-ブタン酸 エチル エステル;臭化水素酸塩

15

MS: m/e (ESI) 640. 2 (MH^+)

実施例 1740

4-[2-第 3 プチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(4-オキソ-ピペリジン-1-イル)-フェノキシ]-ブタン酸 エチル エステル;臭化水素酸塩

20

MS: m/e (ESI) 575. 2 (MH^+)

実施例 1741

4-[2-第 3 プチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(4-オキソ-ピペリジン-1-イル)-フェノキシ]-ブタン酸 エチル エステル;臭化水素酸塩

25

MS: m/e (ESI) 736. 3 (MH^+) (Boc 体)

実施例 1742

4-[2-第 3 プチル-4-[2-(5-エトキシ-4-フルオロ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(4-オキソ-ピペリジン-1-イル)-フェノキシ]-ブタン酸 エチル エステル;臭化水素酸塩

5 MS:m/e(ESI) 653. 2 (MH⁺)

実施例 1743

4-[2-第 3 プチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-フェノキシ]-ブタン酸 エチル エステル;臭化水素酸塩

10 MS:m/e(ESI) 637. 3 (MH⁺)

実施例 1744

4-[2-第 3 プチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-フェノキシ]-ブタン酸 エチル エステル;臭化水素酸塩

15 MS:m/e(ESI) 614. 2 (MH⁺)

実施例 1745

4-[2-第 3 プチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-フェノキシ]-ブタン酸 エチル エステル;臭化水素酸塩

20 MS:m/e(ESI) 642. 3 (MH⁺)

実施例 1746

4-[2-第 3 プチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-フェノキシ]-ブタン酸 エチル エステル;臭化水素酸塩

25 MS:m/e(ESI) 577. 2 (MH⁺)

実施例 1747

4-[2-第 3 プチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-フェノキシ]-ブタン酸 エチル エステル; 臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 738. 2 (MH^+) (Boc 体)

5 実施例 1748

4-[2-第 3 プチル-4-[2-(5-エトキシ-4-フルオロ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-フェノキシ]-ブタン酸 エチル エステル; 臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 655. 1 (MH^+)

10 実施例 1749

4-{2-第 3 プチル-6-(3-カルボキシ-プロポキシ)-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブタン酸; 臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 612. 1 (MH^+)

15 実施例 1750

4-{2-第 3 プチル-6-(3-カルボキシ-プロポキシ)-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブタン酸; 臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 589. 0 (MH^+)

20 実施例 1751

4-{2-第 3 プチル-6-(3-カルボキシ-プロポキシ)-4-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブタン酸; 臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 617. 0 (MH^+)

25 実施例 1752

4-{2-第 3 プチル-6-(3-カルボキシ-プロポキシ)-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イ

ミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}ブ

タン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 552.0 (MH⁺)

実施例 1753

5 4-{2-第3ブチル-6-(3-カルボキシプロポキシ)-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-
メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-
フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 613.0 (MH⁺)

実施例 1754

10 5-{2-第3ブチル-6-(4-カルボキシブトキシ)-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-
メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキ
シ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 640.0 (MH⁺)

実施例 1755

15 5-{2-第3ブチル-6-(4-カルボキシブトキシ)-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,
6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペ
ンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 617.0 (MH⁺)

実施例 1756

20 5-{2-第3ブチル-6-(4-カルボキシブトキシ)-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオ
ロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペ
ンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 645.0 (MH⁺)

実施例 1757

25 5-{2-第3ブチル-6-(4-カルボキシブトキシ)-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミ
ノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペ

タン酸;臭化水素酸塩MS:m/e (ESI) 580. 0 (MH⁺)

実施例 1758

5 5-[2-第3ブチル-6-(4-カルボキシ-ブトキシ)-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 641. 0 (MH⁺)

実施例 1759

10 4-[2-第3ブチル-6-(エチル-メチル-アミノ)-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ]-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 544. 2 (MH⁺)

実施例 1760

15 4-[2-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(エチル-メチル-アミノ)-フェノキシ]-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 567. 3 (MH⁺)

実施例 1761

20 4-[2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(エチル-メチル-アミノ)-フェノキシ]-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 507. 3 (MH⁺)

実施例 1762

25 4-[2-第3ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(エチル-メチル-アミノ)-フェノキシ]-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 568. 3 (MH⁺)

実施例 1763

4-[2-第 3 プチル-6-(エチル-メチル-アミノ)-4-[2-(7-イミノ-2-メチル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ]-ブタン酸; 臭化

5 水素酸塩

MS:m/e(ESI) 481. 3 (MH⁺)

実施例 1764

5-[2-第 3 プチル-6-(エチル-メチル-アミノ)-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ]-ペ

10 ンタン酸; 臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 558. 3 (MH⁺)

実施例 1765

5-[2-第 3 プチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(エチル-メチル-アミノ)-フェノキ

15 シ]-ペンタン酸; 臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 581. 3 (MH⁺)

実施例 1766

5-[2-第 3 プチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(エチル-メチル-アミノ)-フェノキシ]-

20 ペンタン酸; 臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 521. 3 (MH⁺)

実施例 1767

5-[2-第 3 プチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(エチル-メチル-アミノ)-フ

25 エノキシ]-ペンタン酸; 臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 582. 3 (MH⁺)

実施例 1768

5-{2-第3ブチル-6-(エチルメチルアミノ)-4-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

5 MS:m/e(ESI) 495.3(MH⁺)

実施例 1769

{2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ジエチルアミノ-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

10 MS:m/e(ESI) 493.3(MH⁺)

実施例 1770

{2-第3ブチル-6-ジエチルアミノ-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

15 MS:m/e(ESI) 554.3(MH⁺)

実施例 1771

{2-第3ブチル-6-ジエチルアミノ-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

20 MS:m/e(ESI) 530.3(MH⁺)

実施例 1772

{2-第3ブチル-6-ジエチルアミノ-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

25 MS:m/e(ESI) 553.4(MH⁺)

実施例 1773

4-{2-第3ブチル-6-(4-シアノ-ピペリジン-1-イル)-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブタン酸 エチル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 586.5 (MH⁺)

5 実施例 1774

4-{2-第3ブチル-6-(4-シアノ-ピペリジン-1-イル)-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブタン酸 エチル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 647.5 (MH⁺)

10 実施例 1775

4-{2-第3ブチル-6-(4-シアノ-ピペリジン-1-イル)-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブタン酸 エチル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 623.5 (MH⁺)

15 実施例 1776

4-{2-第3ブチル-6-(4-シアノ-ピペリジン-1-イル)-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブタン酸 エチル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 651.5 (MH⁺)

20 実施例 1777

4-{2-第3ブチル-6-(4-シアノ-ピペリジン-1-イル)-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブタン酸 エチル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 646.5 (MH⁺)

25 実施例 1778

4-{3-第3ブチル-2-(3-シアノ-プロポキシ)-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-

-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブタン

酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 533. 4 (MH⁺)

実施例 1779

5 4-{3-第3ブチル-2-(3-シアノ-プロポキシ)-5-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 594. 5 (MH⁺)

実施例 1780

10 4-{3-第3ブチル-2-(3-シアノ-プロポキシ)-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 570. 4 (MH⁺)

実施例 1781

15 4-{3-第3ブチル-2-(3-シアノ-プロポキシ)-5-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 598. 5 (MH⁺)

実施例 1782

20 4-{3-第3ブチル-2-(3-シアノ-プロポキシ)-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 593. 5 (MH⁺)

実施例 1783

25 5-{3-第3ブチル-2-(3-シアノ-プロポキシ)-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタ

ン酸;臭化水素酸塩MS:m/e (ESI) 547. 4 (MH⁺)

実施例 1784

5-{3-第3ブチル-2-(3-シアノ-プロポキシ)-5-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 608. 5 (MH⁺)

実施例 1785

5-{3-第3ブチル-2-(3-シアノ-プロポキシ)-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペン

タン酸;臭化水素酸塩MS:m/e (ESI) 584. 5 (MH⁺)

実施例 1786

5-{3-第3ブチル-2-(3-シアノ-プロポキシ)-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペン

タン酸;臭化水素酸塩MS:m/e (ESI) 612. 5 (MH⁺)

実施例 1787

5-{3-第3ブチル-2-(3-シアノ-プロポキシ)-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 607. 2 (MH⁺)

実施例 1788

4-{2-第3ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニルアミノ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 510. 2 (MH⁺)

実施例 1789

4-[2-第 3 プチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニルアミノ]-ブタン酸; 臭化水素

5 酸塩

MS: m/e (ESI) 509. 2 (MH⁺)

実施例 1790

5-[2-第 3 プチル-6-(2-シアノ-エチル)-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ]-ペンタン酸;

10 臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 517. 2 (MH⁺)

実施例 1791

5-[2-第 3 プチル-6-(2-シアノ-エチル)-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ]-ペンタン

15 酸; 臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 554. 2 (MH⁺)

実施例 1792

5-[2-第 3 プチル-6-(2-シアノ-エチル)-4-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ]-ペンタン

20 酸; 臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 582. 3 (MH⁺)

実施例 1793

5-[2-第 3 プチル-6-(2-シアノ-エチル)-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ]-ペンタン酸; 臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 577. 3 (MH⁺)

実施例 1794

4-[2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-1-ソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-チアゾール-2-イル-プロポキシ)-フェノキシ]-ブタン酸;臭化水素酸塩

5 MS:m/e(ESI) 628.2 (MH⁺)

実施例 1795

1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-(2,3-ジエトキシ-5-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピラジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 469.3 (MH⁺)

10 実施例 1796

5-{2-第3ブチル-4-[2-(2,3-ジエトキシ-5-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピラジン-6-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 582.4 (MH⁺)

15 実施例 1797

{2-第3ブチル-4-[2-(2,3-ジエトキシ-5-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピラジン-6-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 540.3 (MH⁺)

20 実施例 1798

4-{3-第3ブチル-5-[2-(2,3-ジエトキシ-5-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピラジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシフェノキシ}-ブチロニチリル;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 496.2 (MH⁺)

25 実施例 1799

4-{2-第3ブチル-4-[2-(2,3-ジエトキシ-5-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]

ピラジン-6-イル)-アセチル]-6-メトキシフェノキシ}-ブチルアミド;臭化水素酸塩MS:m/e(ESI) 528. 3 (MH⁺)

実施例 1800

5 {2-第3ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[2-(2,3-ジエトキシ-5-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピラジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 554. 3 (MH⁺)

実施例 1801

10 5-{2-第3ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[2-(2,3-ジエトキシ-5-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピラジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペントン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 596. 3 (MH⁺)

実施例 1802

15 5-{2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシメチル}-イソオキサゾール-3-カルボン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 558. 3 (MH⁺)

実施例 1803

20 5-{2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシメチル}-4,5-ジヒドロ-イソオキサゾール-3-カルボン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 560. 3 (MH⁺)

実施例 1804

25 5-{2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシメチル}-イ

ソオキサゾール-3-カルボン酸;臭化水素酸塩MS: m/e (ESI) 595. 3 (MH⁺)

実施例 1805

5-{2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-1-ソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシメチル}-4,5-ジヒドロ-イソオキサゾール-3-カルボン酸;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 597. 3 (MH⁺)

実施例 1806

5-{2-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-1-ソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシメチル}-イソオキサゾール-3-カルボン酸;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 618. 3 (MH⁺)

実施例 1807

5-{2-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-1-ソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシメチル}-4,5-ジヒドロ-イソオキサゾール-3-カルボン酸;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 620. 3 (MH⁺)

実施例 1808

5-{2-(2-シアノ-1,1-ジメチル-エチル)-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-1-ソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペニタン酸;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 549. 4 (MH⁺)

実施例 1809

5-{2-第3ブチル-6-(3-シアノ-プロピル)-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-1-ソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペニタン酸;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 591. 4 (MH^+)

実施例 1810

5-{2-第3ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[4-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-3-オキソ-ブチル]-フェニキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 635. 5 (MH^+)

実施例 1811

{2-第3ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[4-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-3-オキソ-ブチル]-フェニキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 593. 4 (MH^+)

実施例 1812

6-{2-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ニコチン酸;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 545. 3 (MH^+)

実施例 1813

2-{2-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシメチル}-シクロプロパンカルボン酸;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 591. 4 (MH^+)

実施例 1814

5-{2-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-モルフォリン-4-イル-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 609. 5 (MH^+)

実施例 1815

5-{2-第3ブチル-6-(3-シアノ-プロピル)-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

5 MS:m/e(ESI) 568.4(MH⁺)

実施例 1816

5-{2-第3ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[4-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-3-オキソ-ブチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

10 MS:m/e(ESI) 612.4(MH⁺)

実施例 1817

{2-第3ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[4-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-3-オキソ-ブチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

15 MS:m/e(ESI) 570.3(MH⁺)

実施例 1818

6-{2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ニコチン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 522.3MH⁺)

20 実施例 1819

2-{2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシメチル}-シクロプロパンカルボン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 568.4(MH⁺)

25 実施例 1820

5-{2-第3ブチル-6-(4-シアノ-ピペリジン-1-イル)-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-

-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸; 臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 609. 4 (MH⁺)

実施例 1821

5 (2-{2-第 3 プチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-エトキシ)-酢酸; 臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 572. 3 (MH⁺)

実施例 1822

10 5-{2-(2-シアノ-1, 1-ジメチル-エチル)-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸; 臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 489. 3 (MH⁺)

実施例 1823

15 5-{2-第 3 プチル-6-(3-シアノ-プロピル)-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸; 臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 531. 4 (MH⁺)

実施例 1824

20 5-{2-第 3 プチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[4-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-3-オキソ-ブチル]-フェノキシ}-ペンタン酸; 臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 575. 4 (MH⁺)

実施例 1825

25 {2-第 3 プチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[4-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-3-オキソ-ブチル]-フェノキシ}

シ}-酢酸;臭化水素酸塩MS:m/e(ESI) 533. 3(MH⁺)

実施例 1826

6-{2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ5 [3,4-b] ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ニコチン酸;臭化水素酸塩MS:m/e(ESI) 485. 2(MH⁺)

実施例 1827

2-{2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b] ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシメチル}-10 シクロプロパンカルボン酸;臭化水素酸塩MS:m/e(ESI) 531. 1(MH⁺)

実施例 1828

5-{2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b] ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-モルフォリン-4-イル-フェノキシ}-ペン15 タン酸;臭化水素酸塩MS:m/e(ESI) 549. 5(MH⁺)

実施例 1829

4-{2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b] ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ピペリジン-1-イル-フェノキシ}-ブタン20 酸;臭化水素酸塩MS:m/e(ESI) 532. 9(MH⁺)

実施例 1830

4-[2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b] ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(4-オキソ-ピペリジン-1-イル)-フェノ25 キシ]-ブタン酸;臭化水素酸塩MS:m/e(ESI) 546. 9(MH⁺)

実施例 1831

4-[2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-フェノキシ]-ブタン酸;臭化水素酸塩

5 MS:m/e(ESI) 548.9 (MH⁺)

実施例 1832

4-{2-第 3 ブチル-6-(4-シアノ-ピペリジン-1-イル)-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

10 MS:m/e(ESI) 557.9 (MH⁺)

実施例 1833

5-[2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(4-オキソ-ピペリジン-1-イル)-フェノキシ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩

15 MS:m/e(ESI) 560.9 (MH⁺)

実施例 1834

5-[2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-フェノキシ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩

20 MS:m/e(ESI) 562.9 (MH⁺)

実施例 1835

5-{2-第 3 ブチル-6-(4-シアノ-ピペリジン-1-イル)-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

25 MS:m/e(ESI) 571.9 (MH⁺)

実施例 1836

(2-{2-第 3 プチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-エトキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 534.8(MH⁺)

5 実施例 1837

5-{2-(2-シアノ-1,1-ジメチル-エチル)-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 549.8(MH⁺)

10 実施例 1838

5-{2-第 3 プチル-6-(3-シアノ-プロピル)-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 591.9(MH⁺)

15 実施例 1839

5-{2-第 3 プチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[4-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-3-オキソ-ブチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 635.9(MH⁺)

20 実施例 1840

{2-第 3 プチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[4-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-3-オキソ-ブチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 593.8(MH⁺)

25 実施例 1841

6-{2-第 3 プチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒ

ドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ニコチン酸;臭化

水素酸塩

MS:m/e (ESI) 545. 8 (MH⁺)

実施例 1842

5 (2-{2-第3ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒ
ドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノ
キシ}-エトキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 595. 9 (MH⁺)

実施例 1843

10 5-{2-(2-シアノ-1,1-ジメチル-エチル)-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イ
ミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン
酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 553. 8 (MH⁺)

実施例 1844

15 5-{2-第3ブチル-6-(3-シアノ-プロピル)-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-
イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタ
ン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 595. 9 (MH⁺)

実施例 1845

20 5-{2-第3ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[4-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ
-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-3-オキソ-ブチル]-フェノキ
シ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 640. 9 (MH⁺)

実施例 1846

25 (6-{2-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒ
ドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ピリジン-3-イル)-酢酸;

臭化水素酸塩MS:m/e (ESI) 559. 1 (MH⁺)

実施例 1847

5-{2-(シアノ-ジメチル-メチル)-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン

5
酸;臭化水素酸塩MS:m/e (ESI) 535. 2 (MH⁺)

実施例 1848

3-[2-第 3 ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-チアゾール-2-イル-プロポキシ)-フェノキシ]-プロピオン酸;臭化水素酸塩

10
MS:m/e (ESI) 637. 3 (MH⁺)

実施例 1849

5-[2-第 3 ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-チアゾール-2-イル-プロポキシ)-フェノキシ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩

15
MS:m/e (ESI) 665. 3 (MH⁺)

実施例 1850

(6-{2-第 3 ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ピリジン-3-イル)-酢酸;臭化水素酸塩

20
MS:m/e (ESI) 536. 2 (MH⁺)

実施例 1851

5-{2-(シアノ-ジメチル-メチル)-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 512. 2 (MH+)

実施例 1852

5-[2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-1-ソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-チアゾール-2-イル-プロポキシ)-フェノキシ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 642. 3 (MH+)

実施例 1853

(6-{2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-1-ソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ピリジン-3-イル)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 564. 2 (MH+)

実施例 1854

5-{2-(シアノ-ジメチル-メチル)-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-1-ソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 540. 2 (MH+)

実施例 1855

5-[2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-1-ソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-チアゾール-2-イル-プロポキシ)-フェノキシ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 670. 2 (MH+)

実施例 1856

(6-{2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ピリジン-3-イル)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 499. 1 (MH+)

実施例 1857

5-{2-(シアノ-ジメチル-メチル)-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

5 MS:m/e(ESI) 475.2(MH⁺)

実施例 1858

4-[2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(3-チアゾール-2-イル-プロポキシ)-フェノキシ]-ブタン酸;臭化水素酸塩

10 MS:m/e(ESI) 591.2(MH⁺)

実施例 1859

5-[2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(3-チアゾール-2-イル-プロポキシ)-フェノキシ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩

15 MS:m/e(ESI) 605.2(MH⁺)

実施例 1860

(6-{2-第3ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ピリジン-3-イル)-酢酸;臭化水素酸塩

20 MS:m/e(ESI) 560.1(MH⁺)

実施例 1861

5-{2-(シアノ-ジメチル-メチル)-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペ
ンタン酸;臭化水素酸塩

25 MS:m/e(ESI) 536.2(MH⁺)

実施例 1862

4-[2-第3ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(3-チアゾール-2-イル-プロポキシ)-フェノキシ]-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 652. 2 (MH⁺)

5 実施例 1863

5-[2-第3ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(3-チアゾール-2-イル-プロポキシ)-フェノキシ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 666. 2 (MH⁺)

10 実施例 1864

4-{5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-3,3-ジメチル-2,3-ジヒドロ-インドール-1-イル}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 506. 3 (MH⁺)

15 実施例 1865

4-{5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-3,3-ジメチル-2,3-ジヒドロ-インドール-1-イル}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 483. 3 (MH⁺)

20 実施例 1866

4-{5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-3,3-ジメチル-2,3-ジヒドロ-インドール-1-イル}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 511. 3 (MH⁺)

25 実施例 1867

4-{5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-

イル)-アセチル]-3,3-ジメチル-2,3-ジヒドロ-インドール-1-イル}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 447.3 (MH⁺)

実施例 1868

5 4-{5-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-3,3-ジメチル-2,3-ジヒドロ-インドール-1-イル}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 508.3 (MH⁺)

実施例 1869

10 {3-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-5-ピロリジン-1-イルフェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 495.3 (MH⁺)

実施例 1870

15 4-{3-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-5-ピロリジン-1-イルフェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 523.3 (MH⁺)

実施例 1871

20 5-{3-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-5-ピロリジン-1-イルフェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 537.3 (MH⁺)

実施例 1872

25 {3-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-5-ピロリジン-1-イルフェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 472.2 (MH⁺)

実施例 1873

4-[3-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-5-ピロリジン-1-イル-フェノキシ]-ブタン酸;臭化水素酸塩
 MS:m/e(ESI) 500. 2 (MH+)

5 実施例 1874

5-[3-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-5-ピロリジン-1-イル-フェノキシ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 514. 3 (MH+)

10 実施例 1875

{3-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-5-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 435. 2 (MH+)

実施例 1876

15 4-[3-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-5-ピロリジン-1-イル-フェノキシ]-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 463. 3 (MH+)

実施例 1877

20 5-[3-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-5-ピロリジン-1-イル-フェノキシ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 477. 3 (MH+)

実施例 1878

{3-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-5-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-酢酸;
 25 臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 496. 2 (MH+)

実施例 1879

4-[3-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-5-ピロリジン-1-イル-フェノキシ]-ブタン酸;臭化水素酸塩

5 MS:m/e(ESI) 524. 3 (MH⁺)

実施例 1880

5-[3-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-5-ピロリジン-1-イル-フェノキシ]-ペンタノン酸;臭化水素酸塩

10 MS:m/e(ESI) 538. 3 (MH⁺)

実施例 1881

{3-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-5-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 500. 2 (MH⁺)

15 実施例 1882

4-{3-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-5-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 528. 2 (MH⁺)

実施例 1883

20 5-{3-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-5-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 542. 3 (MH⁺)

実施例 1884

25 2-{2-[3-第3ブチル-4-(メタンスルfonyルメチルアミノ)-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチ

ルアミド;臭化水素酸塩MS:m/e(ESI) 515. 5 (MH⁺)

実施例 1885

5-[2-第 3 プチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-チオフェン-2-イル-プロポキシ)-フェノキシ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 664. 3 (MH⁺)

実施例 1886

[2-第 3 プチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(2-メチル-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 565. 2 (MH⁺)

実施例 1887

5-[2-第 3 プチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(2-メチル-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 607. 3 (MH⁺)

実施例 1888

{2-第 3 プチル-4-[4-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-3-オキソ-ブチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 579. 3 (MH⁺)

実施例 1889

4-{2-第 3 プチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ピペリジン-1-イル-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 593. 3 (MH⁺)

実施例 1890

5-[2-第3ブチル-6-(4-シアノ-ピペリジン-1-イル)-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩

5

MS:m/e (ESI) 632. 3 (MH⁺)

実施例 1891

N-[2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル]-N-メチル-メタンスルфонアミド;臭化水素酸塩

10

MS:m/e (ESI) 492. 2 (MH⁺)

実施例 1892

5-[2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-チオフェン-2-イル-プロポキシ)-フェノキシ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩

15

MS:m/e (ESI) 641. 2 (MH⁺)

実施例 1893

[2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(2-メチル-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;臭化水素酸塩

20

MS:m/e (ESI) 542. 2 (MH⁺)

実施例 1894

5-[2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(2-メチル-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩

25

MS:m/e (ESI) 584. 3 (MH⁺)

実施例 1895

5-[2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-1-ソインドール-2-イル)-アセチル]-6-モルフォリン-4-イル-フェノキシ]-ペンタ
ン酸;臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 586. 3 (MH+)

実施例 1896

N-[2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-1-ソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル]-N-メチル-メタンスルfonyアミ
ド;臭化水素酸塩

10 MS:m/e (ESI) 520. 2 (MH+)

実施例 1897

5-[2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-1-ソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-チオフェン-2-イル-プロポキシ)-フェノ
キシ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩

15 MS:m/e (ESI) 669. 3 (MH+)

実施例 1898

[2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-1-ソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(2-メチル-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-
酢酸;臭化水素酸塩

20 MS:m/e (ESI) 570. 3 (MH+)

実施例 1899

5-[2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-1-ソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(2-メチル-ピロリジン-1-イル)-フェノキ
シ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩

25 MS:m/e (ESI) 612. 3 (MH+)

実施例 1900

{2-第3ブチル-4-[4-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-3-オキソ-ブチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 584. 3 (MH⁺)

5 実施例 1901

5-{2-第3ブチル-6-(4-シアノ-ピペリジン-1-イル)-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 637. 2 (MH⁺)

10 実施例 1902

5-[2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(3-チオフェン-2-イル-プロポキシ)-フェノキシ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 604. 2 (MH⁺)

15 実施例 1903

[2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(2-メチル-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 505. 2 (MH⁺)

20 実施例 1904

{2-第3ブチル-4-[4-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-3-オキソ-ブチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 519. 2 (MH⁺)

25 実施例 1905

6-{2-[3-第3ブチル-4-(メタンスルfonyルメチル-アミノ)-フェニル]-2-オキ

ゾ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-

カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 516. 1 (MH⁺)

実施例 1906

5 5-[2-第3ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(3-チオフェン-2-イル-プロポキシ)-フェノキシ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 665. 2 (MH⁺)

実施例 1907

10 {2-第3ブチル-4-[4-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-3-オキソ-ブチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 556. 2 (MH⁺)

実施例 1908

15 4-{2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ピペリジン-1-イル-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 570. 3 (MH⁺)

実施例 1909

20 N-{2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル}-N-メチル-メタンスルフォンアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 455. 2 (MH⁺)

実施例 1910

25 5-[2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(2-メチル-ピロリジン-1-イル)-フェノ

キシ]-ペントン酸;臭化水素酸塩MS:m/e(ESI) 547. 3 (MH⁺)

実施例 1911

[2-第 3 プチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(2-メチル-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 566. 2 (MH⁺)

実施例 1912

5-[2-第 3 プチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(2-メチル-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-ペントン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 608. 2 (MH⁺)

実施例 1913

{2-第 3 プチル-4-[4-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-3-オキソ-ブチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 580. 2 (MH⁺)

実施例 1914

5-{2-第 3 プチル-6-(4-シアノ-ピペリジン-1-イル)-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペントン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 633. 2 (MH⁺)

実施例 1915

2-{2-[3-(アセチル-メチル-アミノ)-5-第 3 プチル-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 479. 4 (MH^+)

実施例 1916

{2-第 3 プチル-4-[3-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-2-オキソ-プロピル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

5

MS: m/e (ESI) 565. 4 (MH^+)

実施例 1917

{2-第 3 プチル-4-[3-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-2-オキソ-プロピル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

10

MS: m/e (ESI) 570. 4 (MH^+)

実施例 1918

N-{3-第 3 プチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-N-メチル-アセトアミド;臭化水素酸塩

15

MS: m/e (ESI) 456. 3 (MH^+)

実施例 1919

{2-第 3 プチル-4-[3-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-2-オキソ-プロピル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

20

MS: m/e (ESI) 542. 1 (MH^+)

実施例 1920

5-{2-第 3 プチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-2-フルオロ-ペンタン酸;臭化水素酸塩

25

MS: m/e (ESI) 588. 2 (MH^+)

実施例 1921

{2-第 3 プチル-4-[3-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-2-オキソ-プロピル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

5 MS:m/e(ESI) 505.2 (MH⁺)

実施例 1922

5-{2-第 3 プチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-2-フルオロ-ペンタン酸;臭化水素酸塩

10 MS:m/e(ESI) 551.3 (MH⁺)

実施例 1923

6-{2-[3-(アセチル-メチル-アミノ)-5-第 3 プチル-フェニル]-2-オキソ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

15 MS:m/e(ESI) 480.3 (MH⁺)

実施例 1924

{2-第 3 プチル-4-[3-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-2-オキソ-プロピル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

20 MS:m/e(ESI) 566.3 (MH⁺)

実施例 1925

4-[2-第 3 プチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-チオフェン-2-イル-プロポキシ)-フェノキシ]-ブタン酸;臭化水素酸塩

25 MS:m/e(ESI) 650.2 (MH⁺)

実施例 1926

4-[2-第 3 プチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-[(3-フルオロ-プロピル)-メチル-アミノ]-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 599. 2 (MH⁺)

5 実施例 1927

5-{2-第 3 プチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-[(2-メトキシ-エチル)-メチル-アミノ]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 611. 3 (MH⁺)

10 実施例 1928

{8-第 3 プチル-4-シクロプロピル-6-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキサジン-3-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 563. 2 (MH⁺)

15 実施例 1929

5-{4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-イソプロポキシ-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 526. 2 (MH⁺)

20 実施例 1930

2-[2-(8-第 3 プチル-4-メタンスルフォニル-3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキサジン-6-イル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 543. 2 (MH⁺)

25 実施例 1931

4-[2-第 3 プチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イ

ソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-チオフェン-2-イル-プロポキシ)-フェノキシ]-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 627. 2(MH⁺)

実施例 1932

5 4-{2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-1-ソインドール-2-イル)-アセチル]-6-[(3-フルオロ-プロピル)-メチル-アミノ]-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 576. 3(MH⁺)

実施例 1933

10 5-{2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-1-ソインドール-2-イル)-アセチル]-6-[(2-メトキシ-エチル)-メチル-アミノ]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 588. 3(MH⁺)

実施例 1934

15 {8-第3ブチル-4-シクロプロピル-6-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-1-ソインドール-2-イル)-アセチル]-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-3-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 540. 2(MH⁺)

実施例 1935

20 5-{4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-1-ソインドール-2-イル)-アセチル]-2-イソプロポキシ-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 503. 2(MH⁺)

実施例 1936

25 1-(8-第3ブチル-4-メタンスルfonyl-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-1-ソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 520. 2 (MH^+)

実施例 1937

4-[2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(3-チオフェン-2-イル-プロポキシ)-フェノキシ]-ブタン酸;臭化水素酸塩

5 MS: m/e (ESI) 590. 3 (MH^+)

実施例 1938

4-{2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-[(3-フルオロ-プロピル)-メチル-アミノ]-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

10 MS: m/e (ESI) 539. 3 (MH^+)

実施例 1939

5-{2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-[(2-メトキシ-エチル)-メチル-アミノ]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

15 MS: m/e (ESI) 551. 3 (MH^+)

実施例 1940

{8-第 3 ブチル-4-シクロプロピル-6-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-3-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

20 MS: m/e (ESI) 503. 3 (MH^+)

実施例 1941

5-{4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-イソプロポキシ-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

25 MS: m/e (ESI) 466. 2 (MH^+)

実施例 1942

1-(8-第3ブチル-4-メタンスルフォニル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル)-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 483. 2 (MH⁺)

5 実施例 1943

4-[2-第3ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(3-チオフェン-2-イル-プロポキシ)-フェノキシ]-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 651. 3 (MH⁺)

10 実施例 1944

4-{2-第3ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-[(3-フルオロ-プロピル)-メチル-アミノ]-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 600. 3 (MH⁺)

15 実施例 1945

5-{2-第3ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-[(2-メトキシ-エチル)-メチル-アミノ]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 612. 3 (MH⁺)

20 実施例 1946

{8-第3ブチル-4-シクロプロピル-6-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-3-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 564. 2 (MH⁺)

25 実施例 1947

5-{4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-[(3-フルオロ-プロピル)-メチル-アミノ]-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

[3, 4-b] ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-イソプロポキシフェノキシ}-ペンタン

酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 527. 2 (MH⁺)

実施例 1948

5 6-[2-(8-第 3 プチル-4-メタンスルフォニル-3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキサジン-6-イル)-2-オキソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6, 7-ジヒドロ-5H-ピロ
ロ[3, 4-b] ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 544. 1 (MH⁺)

実施例 1949

10 {8-第 3 プチル-6-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-4-メチル-3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]
オキサジン-2-イル}-酢酸 エチル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 565. 4 (MH⁺)

実施例 1950

15 {8-第 3 プチル-6-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-4-メチル-3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキサジン-2-イル}-酢酸 エチル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 542. 3 (MH⁺)

実施例 1951

20 {8-第 3 プチル-6-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-4-メチル-3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキサジン-2-イル}-酢酸 エチル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 505. 4 (MH⁺)

実施例 1952

25 5-{2-第 3 プチル-6-(3-シアノメチル-ピロリジン-1-イル)-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチ

ル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩MS:m/e(ESI) 632. 3 (MH⁺)

実施例 1953

5-{2-第3ブチル-6-(3-シアノメチル-ピロリジン-1-イル)-4-[2-(7-フルオロ-1-
イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェ
ノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 609. 3 (MH⁺)

実施例 1954

5-{2-第3ブチル-6-(3-シアノメチル-ピロリジン-1-イル)-4-[2-(2-シクロプロ
ピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェ
ノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 572. 4 (MH⁺)

実施例 1955

5-{2-第3ブチル-6-(3-シアノメチル-ピロリジン-1-イル)-4-[2-(3-エトキシ-7-
イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-
アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 633. 5 (MH⁺)

実施例 1956

5-{4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソイン

20 ドール-2-イル)-アセチル]-2-イソプロポキシ-6-ピロリジン-1-イル-フェノキ
 シ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 595. 0 (MH⁺)

実施例 1957

5-{4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール

25 -2-イル)-アセチル]-2-イソプロポキシ-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ペ
 タン酸;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 572. 0 (MH^+)

実施例 1958

5-{4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-イソプロポキシ-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ペンタ
5 ン酸;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 535. 1 (MH^+)

実施例 1959

5-{4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-イソプロポキシ-6-ピロリジン-1-イル-10
10 フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 596. 2 (MH^+)

実施例 1960

{8-第3ブチル-6-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベン
15 ゾ[1,4]オキサジン-2-イル}-酢酸 エチル エステル;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 566. 3 (MH^+)

実施例 1961

メチルカルバミン酸 2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水
20 素酸塩

MS: m/e (ESI) 486. 2 (MH^+)

実施例 1962

メチルカルバミン酸 2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水
25 素酸塩

MS: m/e (ESI) 458. 2 (MH^+)

実施例 1963

メチルカルバミン酸 2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

5 MS:m/e(ESI) 421.3 (MH⁺)

実施例 1964

メチルカルバミン酸 2-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

10 MS:m/e(ESI) 481.3 (MH⁺)

実施例 1965

メチルカルバミン酸 2-第3ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

15 MS:m/e(ESI) 482.3 (MH⁺)

実施例 1966

ピロリジン-1-カルボン酸 2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

20 MS:m/e(ESI) 526.4 (MH⁺)

実施例 1967

ピロリジン-1-カルボン酸 2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジエトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

25 MS:m/e(ESI) 498.4 (MH⁺)

実施例 1968

ピロリジン-1-カルボン酸 2-第 3 プチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル エステル; 臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 461. 4 (MH⁺)

5 実施例 1969

ピロリジン-1-カルボン酸 2-第 3 プチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル; 臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 521. 4 (MH⁺)

10 実施例 1970

ピロリジン-1-カルボン酸 2-第 3 プチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5, 7-ジヒドロ-ピロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル エステル; 臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 522. 4 (MH⁺)

15 実施例 1971

(1-{2-ブトキシ-3-第 3 プチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸; 臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 623. 5 (MH⁺)

20 実施例 1972

(1-{2-ブトキシ-3-第 3 プチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸; 臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 600. 4 (MH⁺)

25 実施例 1973

(1-{2-ブトキシ-3-第 3 プチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-

-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸; 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 563. 4 (MH⁺)

実施例 1974

5 (1-{2-ブトキシ-3-第3ブチル-5-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸; 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 624. 5 (MH⁺)

実施例 1975

10 5-[2-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-メトキシメチル-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-ペンタン酸; 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 637. 5 (MH⁺)

実施例 1976

15 5-[2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-メトキシメチル-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-ペンタン酸; 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 614. 4 (MH⁺)

実施例 1977

20 5-[2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(3-メトキシメチル-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-ペンタン酸; 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 577. 4 (MH⁺)

実施例 1978

25 5-[2-第3ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(3-メトキシメチル-ピロリ

ジン-1-イル)-フェノキシ]-ペニンタン酸;臭化水素酸塩MS:m/e(ESI) 638. 5 (MH⁺)

実施例 1979

[2-第 3 ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-メトキシメチル-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 595. 4 (MH⁺)

実施例 1980

[2-第 3 ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-メトキシメチル-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 572. 3 (MH⁺)

実施例 1981

[2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(3-メトキシメチル-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 535. 3 (MH⁺)

実施例 1982

[2-第 3 ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(3-メトキシメチル-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 596. 4 (MH⁺)

実施例 1983

{8-第 3 ブチル-6-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-4-メチル-3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキサジン-2-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 537. 3 (MH+)

実施例 1984

{8-第3ブチル-6-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-2-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

5

MS:m/e (ESI) 514. 3 (MH+)

実施例 1985

{8-第3ブチル-6-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-2-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

10

MS:m/e (ESI) 477. 3 (MH+)

実施例 1986

{8-第3ブチル-6-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-2-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

15

MS:m/e (ESI) 538. 3 (MH+)

実施例 1987

2-(1-{3-第3ブチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-ブタン酸;臭化水素酸塩

20

MS:m/e (ESI) 609. 2 (MH+)

実施例 1988

2-(1-{3-第3ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-ブタン酸;臭化水素酸塩

25

MS:m/e (ESI) 586. 2 (MH+)

実施例 1989

2-(1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-ブタン酸;臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 549. 3 (MH⁺)

実施例 1990

2-(1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-ブタン酸;臭化水素酸塩

10 MS:m/e (ESI) 610. 5 (MH⁺)

実施例 1991

2-{2-第 3 ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

15 MS:m/e (ESI) 612. 6 (MH⁺)

実施例 1992

2-{2-第 3 ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

20 MS:m/e (ESI) 584. 5 (MH⁺)

実施例 1993

2-{2-第 3 ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタ
ン酸;臭化水素酸塩

25 MS:m/e (ESI) 547. 5 (MH⁺)

実施例 1994

2-{2-第3ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 607.5 (MH⁺)

5 実施例 1995

2-{2-第3ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 608.5 (MH⁺)

10 実施例 1996

ピロリジン-1,2-ジカルボン酸 1-{2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 570.4 (MH⁺)

15 実施例 1997

ピロリジン-1,2-ジカルボン酸 1-{2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 542.4 (MH⁺)

20 実施例 1998

ピロリジン-1,2-ジカルボン酸 1-{2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル}エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 505.4 (MH⁺)

25 実施例 1999

ピロリジン-1,2-ジカルボン酸 1-{2-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-

メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル} エステル; 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 565. 5 (MH⁺)

実施例 2000

5 ピロリジン-1, 2-ジカルボン酸 1-{2-第3ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-
メチルカルバモイル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-
フェニル} エステル; 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 566. 5 (MH⁺)

実施例 2001

10 8-第3ブチル-6-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソ
インドール-2-イル)-アセチル]-4-メチル-3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキサ
ジン-2-カルボン酸 エチル エステル; 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 528. 4 (MH⁺)

実施例 2002

15 8-第3ブチル-6-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソ
インドール-2-イル)-アセチル]-4-メチル-3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキサ
ジン-2-カルボン酸 エチル エステル; 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 556. 4 (MH⁺)

実施例 2003

20 8-第3ブチル-6-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]
ピリジン-6-イル)-アセチル]-4-メチル-3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキサジ
ン-2-カルボン酸 エチル エステル; 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 491. 5 (MH⁺)

実施例 2004

25 (1-{3-第3ブチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒ
ドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル}-ピペリジン-4-

イルオキシ)-酢酸;臭化水素酸塩MS:m/e(ESI) 594.7(MH⁺)

実施例 2005

(1-{3-第 3 プチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-
5 イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル}-ピペリジン-4-イル
オキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 571.7(MH⁺)

実施例 2006

(1-{3-第 3 プチル-5-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒ
10 ドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル}-ピペリ
ジン-4-イルオキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 595.8(MH⁺)

実施例 2007

1-(3-第 3 プチル-5-ジメチルアミノ-4-メトキシフェニル)-2-(7-フルオロ-1-イ
15 ミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水
素酸塩

MS:m/e(ESI) 458.3(MH⁺)

実施例 2008

1-(3-第 3 プチル-5-ジメチルアミノ-4-メトキシフェニル)-2-(2-シクロプロピ
20 ル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素
酸塩

MS:m/e(ESI) 421.3(MH⁺)

実施例 2009

6-[2-(3-第 3 プチル-5-ジメチルアミノ-4-メトキシフェニル)-2-オキソ-エチ
25 ル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン
酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 482. 4 (MH^+)

実施例 2010

2-[2-(3-第 3 プチル-5-ジメチルアミノ-4-メトキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン

5 酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 480. 4 (MH^+)

実施例 2011

8-第 3 プチル-6-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-2-カルボン酸 エチル エステル;臭化水素酸塩

10 10 キサジン-2-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 551. 5 (MH^+)

実施例 2012

{8-第 3 プチル-6-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-3-オキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]

15 オキサジン-2-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 537. 3 (MH^+)

実施例 2013

{8-第 3 プチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソ

20 インドール-2-イル)-アセチル]-3-オキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサ

ジン-2-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 542. 3 (MH^+)

実施例 2014

{8-第 3 プチル-6-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソ

25 インドール-2-イル)-アセチル]-3-オキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサ

ジン-2-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 514. 3 (MH^+)

実施例 2015

{8-第3ブチル-6-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-3-オキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-2-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

5 MS:m/e(ESI) 477.3(MH+)

実施例 2016

{8-第3ブチル-6-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-3-オキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-2-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

10 MS:m/e(ESI) 538.3(MH+)

実施例 2017

メタンスルfonyl酸 2-第3ブチル-4-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

15 MS:m/e(ESI) 500.8(MH+)

実施例 2018

メタンスルfonyl酸 2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

20 MS:m/e(ESI) 506.8(MH+)

実施例 2019

メタンスルfonyl酸 2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

25 MS:m/e(ESI) 478.8(MH+)

実施例 2020

メタンスルфон酸 2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 441. 9 (MH⁺)

5 実施例 2021

メタンスルfon酸 2-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 501. 9 (MH⁺)

10 実施例 2022

メタンスルfon酸 2-第3ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 502. 9 (MH⁺)

15 実施例 2023

メチルカルバミン酸 2-第3ブチル-4-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 480. 0 (MH⁺)

20 実施例 2024

(1-{3-第3ブチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-ピペリジン-4-イルオキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 565. 0 (MH⁺)

25 実施例 2025

(1-{3-第3ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-

イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-ピペリジン-4-イルオキシ)-酢

酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 542. 0 (MH⁺)

実施例 2026

5 (1-{3-第 3 プチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル}-ピペリジン-4-イルオキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 505. 0 (MH⁺)

実施例 2027

10 (1-{3-第 3 プチル-5-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル}-ピペリジン-4-イルオキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 566. 0 (MH⁺)

実施例 2028

15 ジメチルカルバミン酸 2-第 3 プチル-4-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 493. 9 (MH⁺)

実施例 2029

20 ジメチルカルバミン酸 2-第 3 プチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 499. 9 (MH⁺)

実施例 2030

25 ジメチルカルバミン酸 2-第 3 プチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジエトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化

水素酸塩MS: m/e (ESI) 471. 8 (MH⁺)

実施例 2031

ジメチルカルバミン酸 2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 434. 9 (MH⁺)

実施例 2032

ジメチルカルバミン酸 2-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 494. 9 (MH⁺)

実施例 2033

ジメチルカルバミン酸 2-第3ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 495. 9 (MH⁺)

実施例 2034

2-[2-(3-第3ブチル-5-エトキシ-4-メトキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 480. 9 (MH⁺)

実施例 2035

1-(3-第3ブチル-5-エトキシ-4-メトキシフェニル)-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 486. 9 (MH⁺)

実施例 2036

1-(3-第 3 プチル-5-エトキシ-4-メトキシフェニル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-2-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 458. 9 (MH⁺)

実施例 2037

1-(3-第 3 プチル-5-エトキシ-4-メトキシフェニル)-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 421. 9 (MH⁺)

実施例 2038

2-[2-(3-第 3 プチル-5-エトキシ-4-メトキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 481. 9 (MH⁺)

実施例 2039

6-[2-(3-第 3 プチル-5-エトキシ-4-メトキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6, 7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 482. 9 (MH⁺)

実施例 2040

2-{2-第 3 プチル-4-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-3-フェニル-プロピオン酸; 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 571. 0 (MH⁺)

実施例 2041

2-{2-第 3 プチル-4-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-1-

ソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-3-フェニル-プロピオン酸;臭化

水素酸塩

MS:m/e (ESI) 577.0 (MH⁺)

実施例 2042

5 2-{2-第 3 プチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イ

ソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-3-フェニル-プロピオン酸;臭化

水素酸塩

MS:m/e (ESI) 548.9 (MH⁺)

実施例 2043

10 2-{2-第 3 プチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ

[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-3-フェニル-プロピオン酸;臭

化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 511.9 (MH⁺)

実施例 2044

15 2-{2-第 3 プチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒ

ドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-3-フェニル-プロピオン

酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 572.0 (MH⁺)

実施例 2045

20 2-{2-第 3 プチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒ

ドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-3-フェニル-プロ

ピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 573.0 (MH⁺)

実施例 2046

25 2-[2-(8-第 3 プチル-4-シアノメチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン

-6-イル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソイント

ール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩MS:m/e(ESI) 504. 3 (MH⁺)

実施例 2047

6-[2-(8-第 3 プチル-4-シアノメチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル)-2-オキソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 505. 3 (MH⁺)

実施例 2048

{8-第 3 プチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-1イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-アセトニトリル;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 509. 4 (MH⁺)

実施例 2049

{8-第 3 プチル-6-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-アセトニトリル;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 444. 3 (MH⁺)

実施例 2050

2-[2-(8-第 3 プチル-4-シアノメチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル)-2-オキソ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 503. 4 (MH⁺)

実施例 2051

2-{2-[8-第 3 プチル-4-(3H-[1,2,3]トリアゾール-4-イルメチル)-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 546. 0 (MH⁺)

実施例 2052

6-[2-[8-第 3 プチル-4-(3H-[1, 2, 3]トリアゾール-4-イルメチル)-3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキサジン-6-イル]-2-オキソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6, 7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

5

MS:m/e (ESI) 547. 0 (MH⁺)

実施例 2053

1-[8-第 3 プチル-4-(3H-[1, 2, 3]トリアゾール-4-イルメチル)-3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキサジン-6-イル]-2-(5, 6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

10

MS:m/e (ESI) 551. 0 (MH⁺)

実施例 2054

1-[8-第 3 プチル-4-(3H-[1, 2, 3]トリアゾール-4-イルメチル)-3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキサジン-6-イル]-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

15

MS:m/e (ESI) 486. 0 (MH⁺)

実施例 2055

2-{2-[8-第 3 プチル-4-(3H-[1, 2, 3]トリアゾール-4-イルメチル)-3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキサジン-6-イル]-2-オキソ-エチル}-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

20

MS:m/e (ESI) 545. 0 (MH⁺)

実施例 2056

{8-第 3 プチル-6-[2-(5-エトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-6-メトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-3-オキソ-3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]

25

オキサジン-2-イル}-酢酸;臭化水素酸塩MS: m/e (ESI) 528. 3 (MH⁺)

実施例 2057

2-[8-第 3 ブチル-6-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 536. 8 (MH⁺)

実施例 2058

2-[8-第 3 ブチル-6-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 537. 8 (MH⁺)

実施例 2059

2-[8-第 3 ブチル-6-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 513. 8 (MH⁺)

実施例 2060

2-[8-第 3 ブチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 541. 9 (MH⁺)

実施例 2061

2-[8-第 3 ブチル-6-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 476. 9 (MH⁺)

実施例 2062

2-[8-第 3 プチル-6-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル
-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2, 3-ジヒドロ-ベンゾ[1, 4]

5 オキサジン-4-イル]-プロピオニ酸; 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 536. 0 (MH⁺)

実施例 2063

2-{2-[8-第 3 プチル-4-(1H-テトラゾール-5-イルメチル)-3, 4-ジヒドロ-2H-ベン
ゾ[1, 4]オキサジン-6-イル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒ

10 ドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 546. 8 (MH⁺)

実施例 2064

6-{2-[8-第 3 プチル-4-(1H-テトラゾール-5-イルメチル)-3, 4-ジヒドロ-2H-ベン
ゾ[1, 4]オキサジン-6-イル]-2-オキソ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6, 7-ジヒ

15 ドロ-5H-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 548. 3 (MH⁺)

実施例 2065

1-[8-第 3 プチル-4-(1H-テトラゾール-5-イルメチル)-3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ
[1, 4]オキサジン-6-イル]-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒド

20 ロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 523. 8 (MH⁺)

実施例 2066

1-[8-第 3 プチル-4-(1H-テトラゾール-5-イルメチル)-3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ
[1, 4]オキサジン-6-イル]-2-(5, 6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒド

25 ロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 552. 3 (MH⁺)

実施例 2067

1-[8-第 3 プチル-4-(1H-テトラゾール-5-イルメチル)-3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキサジン-6-イル]-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 487. 3 (MH⁺)

実施例 2068

2-{2-[8-第 3 プチル-4-(1H-テトラゾール-5-イルメチル)-3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキサジン-6-イル]-2-オキソ-エチル}-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

10 MS:m/e (ESI) 546. 3 (MH⁺)

実施例 2069

{8-第 3 プチル-4-シアノメチル-6-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-3-オキソ-3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキサジン-2-イル}-酢酸; 臭化水素酸塩

15 MS:m/e (ESI) 576. 3 (MH⁺)

実施例 2070

{8-第 3 プチル-4-シアノメチル-6-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-3-オキソ-3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキサジン-2-イル}-酢酸; 臭化水素酸塩

20 MS:m/e (ESI) 581. 3 (MH⁺)

実施例 2071

{8-第 3 プチル-4-シアノメチル-6-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-3-オキソ-3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキサジン-2-イル}-酢酸; 臭化水素酸塩

25 MS:m/e (ESI) 553. 3 (MH⁺)

実施例 2072

{8-第 3 プチル-4-シアノメチル-6-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-3-オキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-2-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 516. 3 (MH⁺)

5 実施例 2073

{8-第 3 プチル-4-シアノメチル-6-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-3-オキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-2-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 577. 3 (MH⁺)

10 実施例 2074

{8-第 3 プチル-4-カルバモイルメチル-6-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-3-オキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-2-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 594. 3 (MH⁺)

15 実施例 2075

{8-第 3 プチル-4-カルバモイルメチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-3-オキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-2-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 599. 3 (MH⁺)

20 実施例 2076

{8-第 3 プチル-4-カルバモイルメチル-6-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-3-オキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-2-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 571. 2 (MH⁺)

25 実施例 2077

{8-第 3 プチル-4-カルバモイルメチル-6-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-

ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-3-オキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-2-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 534. 2 (MH⁺)

実施例 2078

5 {8-第3ブチル-4-カルバモイルメチル-6-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-3-オキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-2-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 595. 3 (MH⁺)

実施例 2079

10 2-[2-(3-第3ブチル-4-シアノメトキシ-5-エトキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 505. 9 (MH⁺)

実施例 2080

15 {2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-1イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-エトキシフェノキシ}-アセトニトリル;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 511. 8 (MH⁺)

実施例 2081

20 {2-第3ブチル-6-エトキシ-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-1イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-アセトニトリル;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 483. 8 (MH⁺)

実施例 2082

25 {2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-エトキシフェノキシ}-アセトニトリル;臭化水

素酸塩MS:m/e(ESI) 446.9(MH⁺)

実施例 2083

2-[2-(3-第3ブチル-4-シアノメトキシ-5-エトキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 506.9(MH⁺)

実施例 2084

6-[2-(3-第3ブチル-4-シアノメトキシ-5-エトキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 507.9(MH⁺)

実施例 2085

2-[2-(3-第3ブチル-4-シアノメトキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 461.9(MH⁺)

実施例 2086

{2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-1イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-アセトニトリル;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 467.9(MH⁺)

実施例 2087

{2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-1イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-アセトニトリル;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 439.9(MH⁺)

実施例 2088

{2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]

ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-アセトニトリル;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 402. 9 (MH⁺)

実施例 2089

5 2-[2-(3-第3ブチル-4-シアノメトキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキ
シ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸
塩

MS:m/e(ESI) 462. 9 (MH⁺)

実施例 2090

10 6-[2-(3-第3ブチル-4-シアノメトキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-3-エトキ
シ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミ
ド;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 463. 9 (MH⁺)

実施例 2091

15 2-[2-(3-第3ブチル-5-シアノメトキシ-4-メトキシフェニル)-2-オキソ-エチ
ル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミ
ド;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 493. 2 (MH⁺)

実施例 2092

20 2-[2-(3-第3ブチル-5-シアノメトキシ-4-メトキシフェニル)-2-オキソ-エチ
ル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン
酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 492. 3 (MH⁺)

実施例 2093

25 {3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-1ソ
イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェノキシ}-アセトニトリル;臭化

水素酸塩MS:m/e (ESI) 498. 3 (MH⁺)

実施例 2094

{3-第3ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェノキシ}-アセトニトリル;臭化

5

水素酸塩MS:m/e (ESI) 470. 3 (MH⁺)

実施例 2095

6-[2-(3-第3ブチル-5-シアノメトキシ-4-メトキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン

10

酸メチルアミド;臭化水素酸塩MS:m/e (ESI) 494. 3 (MH⁺)

実施例 2096

{3-第3ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシフェノキシ}-アセトニトリル;臭化水

15

素酸塩MS:m/e (ESI) 433. 3 (MH⁺)

実施例 2097

2-{2-[3-第3ブチル-5-(3-シアノ-プロポキシ)-4-メトキシフェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

20

MS:m/e (ESI) 521. 3 (MH⁺)

実施例 2098

2-{2-[3-第3ブチル-5-(3-シアノ-プロポキシ)-4-メトキシフェニル]-2-オキソ-エチル}-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

25

MS:m/e (ESI) 520. 4 (MH⁺)

実施例 2099

4-[3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-1-ソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェノキシ]-ブチロニチリル;臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 526. 4 (MH⁺)

実施例 2100

4-[3-第3ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-1-ソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェノキシ]-ブチロニチリル;臭化水素酸塩

10 MS:m/e (ESI) 498. 3 (MH⁺)

実施例 2101

6-[2-[3-第3ブチル-5-(3-シアノ-プロポキシ)-4-メトキシフェニル]-2-オキソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

15 MS:m/e (ESI) 522. 4 (MH⁺)

実施例 2102

4-[3-第3ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシフェノキシ]-ブチロニチリル;臭化水素酸塩

20 MS:m/e (ESI) 461. 3 (MH⁺)

実施例 2103

2-[2-(3-第3ブチル-4-シアノメトキシ-5-ジメチルアミノ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

25 MS:m/e (ESI) 504. 8 (MH⁺)

実施例 2104

{2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ジメチルアミノフェノキシ}-アセトニトリル;臭化水素酸塩

5 MS:m/e(ESI) 510.8(MH⁺)

実施例 2105

{2-第3ブチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-アセトニトリル;臭化水素酸塩

10 MS:m/e(ESI) 482.8(MH⁺)

実施例 2106

{2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ジメチルアミノフェノキシ}-アセトニトリル;臭化水素酸塩

15 MS:m/e(ESI) 445.9(MH⁺)

実施例 2107

2-[2-(3-第3ブチル-4-シアノメトキシ-5-ジメチルアミノフェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

20 MS:m/e(ESI) 505.9(MH⁺)

実施例 2108

6-[2-(3-第3ブチル-4-カルバモイルメトキシ-5-ジメチルアミノフェニル)-2-オキソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

25 MS:m/e(ESI) 524.9(MH⁺)

実施例 2109

2-{8-第3ブチル-6-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-2-メチル-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 551.4(MH⁺)

5 実施例 2110

2-{8-第3ブチル-6-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-2-メチル-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 552.4(MH⁺)

10 実施例 2111

2-{8-第3ブチル-6-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-2-メチル-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 528.3(MH⁺)

15 実施例 2112

2-{8-第3ブチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-2-メチル-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 556.4(MH⁺)

20 実施例 2113

2-{8-第3ブチル-6-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-2-メチル-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 491.4(MH⁺)

25 実施例 2114

2-{8-第3ブチル-6-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル

-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2, 3-ジヒドロ-ベンゾ[1, 4]

オキサジン-4-イル}-2-メチル-プロピオン酸; 臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 550. 4 (MH⁺)

実施例 2115

5 2-[2-(3-第3ブチル-4-メトキシ-5-モルフォリン-4-イル-フェニル)-2-オキソ-
エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチル
アミド; 臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 523. 4 (MH⁺)

実施例 2116

10 1-(3-第3ブチル-4-メトキシ-5-モルフォリン-4-イル-フェニル)-2-(5, 6-ジエチ
キシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 臭
化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 528. 4 (MH⁺)

実施例 2117

15 1-(3-第3ブチル-4-メトキシ-5-モルフォリン-4-イル-フェニル)-2-(7-フルオロ
-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 臭
化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 500. 3 (MH⁺)

実施例 2118

20 1-(3-第3ブチル-4-メトキシ-5-モルフォリン-4-イル-フェニル)-2-(2-シクロプ
ロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン; 臭化
水素酸塩

MS: m/e (ESI) 463. 4 (MH⁺)

実施例 2119

25 2-[2-(3-第3ブチル-4-メトキシ-5-ピロリジン-1-イル-フェニル)-2-オキソ-エ
チル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボ

ン酸メチルアミド;臭化水素酸塩MS:m/e(ESI) 506.0(MH⁺)

実施例 2120

1-(3-第3ブチル-4-メトキシ-5-ピロリジン-1-イル-フェニル)-2-(5,6-ジエチキ
5 シ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化
水素酸塩

MS:m/e(ESI) 512.0(MH⁺)

実施例 2121

1-(3-第3ブチル-4-メトキシ-5-ピロリジン-1-イル-フェニル)-2-(7-フルオロ
10 -1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭
化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 483.9(MH⁺)

実施例 2122

1-(3-第3ブチル-4-メトキシ-5-ピロリジン-1-イル-フェニル)-2-(2-シクロプロ
15 ピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水
素酸塩

MS:m/e(ESI) 447.0(MH⁺)

実施例 2123

2-[2-(3-第3ブチル-4-メトキシ-5-ピロリジン-1-イル-フェニル)-2-オキソ-エ
20 チル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルア
ミド;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 507.0(MH⁺)

実施例 2124

6-[2-(3-第3ブチル-4-メトキシ-5-ピロリジン-1-イル-フェニル)-2-オキソ-エ
25 チル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボ
ン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 508. 0 (MH⁺)

実施例 2125

2-[2-(4-シアノメトキシ-3-イソプロピルフェニル)-2-オキソエチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素

5 酸塩

MS: m/e (ESI) 449. 3 (MH⁺)

実施例 2126

2-[2-(4-シアノメトキシ-3-イソプロピルフェニル)-2-オキソエチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルア

10 ミド;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 448. 3 (MH⁺)

実施例 2127

{4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-イソプロピルフェノキシ}-アセトニトリル;臭化水素酸塩

15 MS: m/e (ESI) 454. 3 (MH⁺)

実施例 2128

{4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-イソプロピルフェノキシ}-アセトニトリル;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 426. 3 (MH⁺)

20 実施例 2129

{4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-イソプロピルフェノキシ}-アセトニトリル;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 389. 3 (MH⁺)

実施例 2130

6-[2-(4-カルバモイルメトキシ-3-イソプロピルフェニル)-2-オキソエチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン

酸メチルアミド;臭化水素酸塩MS: m/e (ESI) 468. 4 (MH⁺)

実施例 2131

2-[2-(3-ジメチルアミノ-5-イソプロピル-4-メトキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 467. 3 (MH⁺)

実施例 2132

2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-1-(3-ジメチルアミノ-5-イソプロピル-4-メトキシフェニル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 472. 4 (MH⁺)

実施例 2133

1-(3-ジメチルアミノ-5-イソプロピル-4-メトキシフェニル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 444. 3 (MH⁺)

実施例 2134

2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-1-(3-ジメチルアミノ-5-イソプロピル-4-メトキシフェニル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 407. 3 (MH⁺)

実施例 2135

6-[2-(3-ジメチルアミノ-5-イソプロピル-4-メトキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 468. 4 (MH⁺)

実施例 2136

(1-{3-第 3 プチル-5-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-

イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル}-ピペリジン-4-イル

5 オキシ)-酢酸; 臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 599. 7 (MH⁺)

実施例 2137

(1-{3-第 3 プチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ

[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル}-ピペリジン-4-イル

10 オキシ)-酢酸; 臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 534. 8 (MH⁺)

実施例 2138

(1-{3-第 3 プチル-5-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル

-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル}-ピペ

15 リジン-4-イルオキシ)-酢酸; 臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 593. 9 (MH⁺)

実施例 2139

2-[2-(3-第 3 プチル-5-イソプロポキシ-4-メトキシフェニル)-2-オキソ-エチ

ル]-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミ

20 ド; 臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 495. 9 (MH⁺)

実施例 2140

1-(3-第 3 プチル-5-イソプロポキシ-4-メトキシフェニル)-2-(5, 6-ジエチキシ

-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 臭化水

25 素酸塩

MS: m/e (ESI) 500. 9 (MH⁺)

実施例 2141

1-(3-第3ブチル-5-イソプロポキシ-4-メトキシフェニル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

5 MS:m/e(ESI) 472. 9 (MH⁺)

実施例 2142

1-(3-第3ブチル-5-イソプロポキシ-4-メトキシフェニル)-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-1H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

10 MS:m/e(ESI) 436. 0 (MH⁺)

実施例 2143

6-[2-(3-第3ブチル-5-イソプロポキシ-4-メトキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

15 MS:m/e(ESI) 497. 0 (MH⁺)

実施例 2144

2-[2-(3-第3ブチル-5-イソプロポキシ-4-メトキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

20 MS:m/e(ESI) 495. 0 (MH⁺)

実施例 2145

2-[2-(3-第3ブチルフェニル)-2-オキソ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 408. 3 (MH⁺)

25 実施例 2146

1-(3-第3ブチルフェニル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒ

ドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩MS:m/e(ESI) 385. 3 (MH⁺)

実施例 2147

6-[2-(3-第3ブチルフェニル)-2-オキソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジ5 ヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩MS:m/e(ESI) 409. 3 (MH⁺)

実施例 2148

1-(3-第3ブチル-4-メトキシ-5-モルフォリン-4-イル-フェニル)-2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸10 塩MS:m/e(ESI) 437. 4 (MH⁺)

実施例 2149

1-(3-第3ブチル-4-メトキシ-5-モルフォリン-4-イル-フェニル)-2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸15 塩MS:m/e(ESI) 451. 4 (MH⁺)

実施例 2150

2-{2-[3-第3ブチル-4-メトキシ-5-(4-オキソ-ピペリジン-1-イル)-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール20 -5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩MS:m/e(ESI) 535. 3 (MH⁺)

実施例 2151

1-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル}-ピペリジン-4-オン;臭25 化水素酸塩MS:m/e(ESI) 540. 3 (MH⁺)

実施例 2152

1-[3-第 3 ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-1-イソイソンドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル]-ピペリジン-4-オン; 臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 512. 3 (MH⁺)

実施例 2153

1-[3-第 3 ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル]-ピペリジン-4-オン; 臭化水素酸塩

10 MS:m/e (ESI) 475. 4 (MH⁺)

実施例 2154

6-{2-[3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-(4-オキソ-ピペリジン-1-イル)-フェニル]-2-オキソ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6, 7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

15 MS:m/e (ESI) 536. 4 (MH⁺)

実施例 2155

2-[2-[3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-(2-オキソ-ピペリジン-1-イル)-フェニル]-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソイソンドール-5-酢酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

20 MS:m/e (ESI) 535. 3 (MH⁺)

実施例 2156

1-[3-第 3 ブチル-5-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-1-イソイソンドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル]-ピペリジン-2-オン; 臭化水素酸塩

25 MS:m/e (ESI) 540. 3 (MH⁺)

実施例 2157

1-{3-第3ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-1-ソイソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル}-ピペリジン-2-オン;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 512.4(MH⁺)

5 実施例 2158

1-{3-第3ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピペリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル}-ピペリジン-2-オン;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 475.4(MH⁺)

10 実施例 2159

6-{2-[3-第3ブチル-4-メトキシ-5-(2-オキソ-ピペリジン-1-イル)-フェニル]-2-オキソ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピペリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 536.4(MH⁺)

15 実施例 2160

2-(1-{3-第3ブチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-1-ソイソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル}-ピペリジン-4-イルオキシ)-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 609.1(MH⁺)

20 実施例 2161

2-(1-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-1-ソイソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル}-ピペリジン-4-イルオキシ)-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 614.1(MH⁺)

25 実施例 2162

2-(1-{3-第3ブチル-5-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル

-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル}-ピペ
リジン-4-イルオキシ)-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 608. 1 (MH⁺)

実施例 2163

5 2-(1-{3-第3ブチル-5-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5, 7-ジ
ヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル}-ピペ
リジン-4-イルオキシ)-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 610. 1 (MH⁺)

実施例 2164

10 2-(1-{3-第3ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ
-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル}-ピペリジン-4-イル
オキシ)-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 586. 1 (MH⁺)

実施例 2165

15 2-(1-{3-第3ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ
[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル}-ピペリジン-4-イル
オキシ)-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 549. 1 (MH⁺)

実施例 2166

20 2-{2-[3-第3ブチル-4-メトキシ-5-(4-メトキシ-ピペリジン-1-イル)-フェニ
ル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール
-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 551. 0 (MH⁺)

実施例 2167

25 1-[3-第3ブチル-4-メトキシ-5-(4-メトキシ-ピペリジン-1-イル)-フェニ
ル]-2-(5, 6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-

イル)-エタノン;臭化水素酸塩MS:m/e(ESI) 556.0(MH⁺)

実施例 2168

2-[2-[3-第 3 プチル-4-メトキシ-5-(4-メトキシ-ピペリジン-1-イル)-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 550.1(MH⁺)

実施例 2169

6-[2-[3-第 3 プチル-4-メトキシ-5-(4-メトキシ-ピペリジン-1-イル)-フェニル]-2-オキソ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 552.1(MH⁺)

実施例 2170

1-[3-第 3 プチル-4-メトキシ-5-(4-メトキシ-ピペリジン-1-イル)-フェニル]-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 528.0(MH⁺)

実施例 2171

1-[3-第 3 プチル-4-メトキシ-5-(4-メトキシ-ピペリジン-1-イル)-フェニル]-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 491.0(MH⁺)

実施例 2172

2-[2-[3-第 3 プチル-4-メトキシ-5-(2-オキソ-ピロリジン-1-イル)-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 521. 3 (MH⁺)

実施例 2173

1-[3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-1-ソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル]-ピロリジン-2-オン;臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 526. 3 (MH⁺)

実施例 2174

1-[3-第3ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-1-ソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル]-ピロリジン-2-オン;臭化水素酸塩

10 MS:m/e (ESI) 498. 3 (MH⁺)

実施例 2175

1-[3-第3ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル]-ピロリジン-2-オン;臭化水素酸塩

15 MS:m/e (ESI) 461. 3 (MH⁺)

実施例 2176

6-[2-[3-第3ブチル-4-メトキシ-5-(2-オキソ-ピロリジン-1-イル)-フェニル]-2-オキソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

20 MS:m/e (ESI) 522. 4 (MH⁺)

実施例 2177

{8-第3ブチル-6-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-1-ソインドール-2-イル)-アセチル]-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-2-イルメトキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

25 MS:m/e (ESI) 567. 3 (MH⁺)

実施例 2178

{8-第3ブチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-2-イルメトキシ}-酢酸；臭化水素酸塩

5 MS:m/e(ESI) 572.3(MH⁺)

実施例 2179

{8-第3ブチル-6-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-2-イルメトキシ}-酢酸；臭化水素酸塩

10 MS:m/e(ESI) 544.3(MH⁺)

実施例 2180

{8-第3ブチル-6-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-2-イルメトキシ}-酢酸；臭化水素酸塩

15 MS:m/e(ESI) 507.3(MH⁺)

実施例 2181

{8-第3ブチル-6-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-2-イルメトキシ}-酢酸；臭化水素酸塩

20 MS:m/e(ESI) 568.4(MH⁺)

実施例 2182

2-{2-[3-第3ブチル-4-メトキシ-5-(2-オキソ-オキサゾリジン-3-イル)-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド；臭化水素酸塩

25 MS:m/e(ESI) 523.3(MH⁺)

実施例 2183

3-[3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-1-ソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル]-オキサゾリジン-2-オ
ン;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 528. 3 (MH⁺)

5 実施例 2184

3-[3-第3ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-1-ソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル]-オキサゾリジン-2-オ
ン;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 500. 3 (MH⁺)

10 実施例 2185

3-[3-第3ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル]-オキサゾリジン-2-
オン;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 463. 3 (MH⁺)

15 実施例 2186

6-{2-[3-第3ブチル-4-メトキシ-5-(2-オキソ-オキサゾリジン-3-イル)-フェニル]-2-オキソ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピ
リジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 524. 3 (MH⁺)

20 実施例 2187

1-[3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-1-ソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル]-ピペリジン-4-カルボ
ニトリル;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 551. 0 (MH⁺)

25 実施例 2188

2-[2-[3-第3ブチル-5-(4-シアノ-ピペリジン-1-イル)-4-メトキシフェニ

ル]-2-オキソ-エチル}-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソイン
ドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 545. 1 (MH^+)

実施例 2189

5 6-{2-[3-第 3 ブチル-5-(4-シアノ-ピペリジン-1-イル)-4-メトキシフェニ
ル]-2-オキソ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピ
リジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 547. 0 (MH^+)

実施例 2190

10 1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル}-ピペリジン-4-カルボ
ニトリル;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 523. 0 (MH^+)

実施例 2191

15 1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ
[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル}-ピペリジン-4-カルボ
ニトリル;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 486. 0 (MH^+)

実施例 2192

20 (1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒ
ドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル}-ピペリジン-4-
イル)-酢酸;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 578. 7 (MH^+)

実施例 2193

25 (1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-
イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル}-ピペリジン-4-イ

ル)-酢酸;臭化水素酸塩MS:m/e (ESI) 583. 8 (MH⁺)

実施例 2194

(1-[3-第 3 プチル-5-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル}-ピペリジン-4-イル)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 577. 9 (MH⁺)

実施例 2195

(1-[3-第 3 プチル-5-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル}-ピペリジン-4-イル)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 580. 0 (MH⁺)

実施例 2196

(1-[3-第 3 プチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル}-ピペリジン-4-イル)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 556. 0 (MH⁺)

実施例 2197

(1-[3-第 3 プチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル}-ピペリジン-4-イル)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 519. 0 (MH⁺)

実施例 2198

2-[2-(3-クロロ-5-ジメチルアミノ-4-メトキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 459. 2 (MH^+)

実施例 2199

1-(3-クロロ-5-ジメチルアミノ-4-メトキシフェニル)-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸

5 塩

MS: m/e (ESI) 464. 3 (MH^+)

実施例 2200

1-(3-クロロ-5-ジメチルアミノ-4-メトキシフェニル)-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

10 MS: m/e (ESI) 399. 2 (MH^+)

実施例 2201

2-[2-(3-クロロ-5-ジメチルアミノ-4-メトキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

15 MS: m/e (ESI) 458. 3 (MH^+)

実施例 2202

6-[2-(3-クロロ-5-ジメチルアミノ-4-メトキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

20 MS: m/e (ESI) 460. 3 (MH^+)

実施例 2203

2-[2-(3-ブロモ-5-ジメチルアミノ-4-メトキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

25 MS: m/e (ESI) 505. 3 (MH^+)

実施例 2204

1-(3-ブロモ-5-ジメチルアミノ-4-メトキシフェニル)-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 508. 3 (MH⁺)

5 実施例 2205

1-(3-ブロモ-5-ジメチルアミノ-4-メトキシフェニル)-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 443. 2 (MH⁺)

実施例 2206

10 2-[2-(3-ブロモ-5-ジメチルアミノ-4-メトキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 502. 3 (MH⁺)

実施例 2207

15 6-[2-(3-ブロモ-5-ジメチルアミノ-4-メトキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 504. 3 (MH⁺)

実施例 2208

20 2-[2-(3-ジメチルアミノ-4-メトキシ-5-チアゾール-2-イル-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 508. 3 (MH⁺)

実施例 2209

25 2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-2-イル)-1-(3-ジメチルアミノ-4-メトキシ-5-チアゾール-2-イル-フェニル)-エタノ

ン;臭化水素酸塩MS:m/e (ESI) 513. 3 (MH⁺)

実施例 2210

1-(3-ジメチルアミノ-4-メトキシ-5-チアゾール-2-イルフェニル)-2-(7-フルオ5 ロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩MS:m/e (ESI) 485. 3 (MH⁺)

実施例 2211

2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イ10 ル)-1-(3-ジメチルアミノ-4-メトキシ-5-チアゾール-2-イルフェニル)-エタノン;臭化水素酸塩MS:m/e (ESI) 448. 3 (MH⁺)

実施例 2212

6-ジメチルアミノ-2-[2-(3-ジメチルアミノ-4-メトキシ-5-チアゾール-2-イル-15 フェニル)-2-オキソ-エチル]-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩MS:m/e (ESI) 507. 4 (MH⁺)

実施例 2213

6-[2-(3-ジメチルアミノ-4-メトキシ-5-チアゾール-2-イルフェニル)-2-オキソ20 -エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩MS:m/e (ESI) 508. 3 (MH⁺)

実施例 2214

2-{2-[3-第3ブチル-5-(4-エトキシ-ピペリジン-1-イル)-4-メトキシフェニ25 ル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:_{m/e}(ESI) 565.0(MH⁺)

実施例 2215

1-[3-第 3 ブチル-5-(4-エトキシ-ピペリジン-1-イル)-4-メトキシフェニル]-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

5

MS:_{m/e}(ESI) 570.0(MH⁺)

実施例 2216

1-[3-第 3 ブチル-5-(4-エトキシ-ピペリジン-1-イル)-4-メトキシフェニル]-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

10

MS:_{m/e}(ESI) 542.0(MH⁺)

実施例 2217

2-{2-[3-第 3 ブチル-5-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-4-メトキシフェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

15

MS:_{m/e}(ESI) 537.0(MH⁺)

実施例 2218

1-[3-第 3 ブチル-5-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-4-メトキシフェニル]-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

20

MS:_{m/e}(ESI) 542.0(MH⁺)

実施例 2219

2-{2-[3-第 3 ブチル-5-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-4-メトキシフェニル]-2-オキソ-エチル}-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

25

MS:_{m/e}(ESI) 536.1(MH⁺)

実施例 2220

6-[2-[3-第 3 プチル-5-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

5 MS:_{m/e}(ESI) 538. 1(MH⁺)

実施例 2221

1-[3-第 3 プチル-5-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

10 MS:_{m/e}(ESI) 514. 0(MH⁺)

実施例 2222

1-[3-第 3 プチル-5-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

15 MS:_{m/e}(ESI) 476. 3(MH⁺)

実施例 2223

1-(3-第 3 プチル-4-メトキシ-5-メチルアミノ-フェニル)-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

20 MS:_{m/e}(ESI) 471. 8(MH⁺)

実施例 2224

1-(3-第 3 プチル-4-メトキシ-5-メチルアミノ-フェニル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

25 MS:_{m/e}(ESI) 443. 9(MH⁺)

実施例 2225

1-(3-第3ブチル-4-メトキシ-5-メチルアミノフェニル)-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 407.0 (MH⁺)

5 実施例 2226

メタンスルфон酸 2-第3ブチル-4-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-エトキシフェニル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 545.0 (MH⁺)

10 実施例 2227

メタンスルfon酸 2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-エトキシフェニル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 551.0 (MH⁺)

15 実施例 2228

メタンスルfon酸 2-第3ブチル-6-エトキシ-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 522.9 (MH⁺)

20 実施例 2229

メタンスルfon酸 2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-エトキシフェニル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 486.0 (MH⁺)

25 実施例 2230

メタンスルfon酸 2-第3ブチル-6-エトキシ-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-

メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニルエステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 546.0 (MH⁺)

実施例 2231

5 メタンスルfonyl 酸 2-[第 3 プチル-6-エトキシ-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 547.0 (MH⁺)

実施例 2232

10 2-[2-(3-第 3 プチル-4-メトキシ-5-チアゾール-2-イル-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 521.3 (MH⁺)

実施例 2233

15 1-(3-第 3 プチル-4-メトキシ-5-チアゾール-2-イル-フェニル)-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 526.3 (MH⁺)

実施例 2234

20 1-(3-第 3 プチル-4-メトキシ-5-チアゾール-2-イル-フェニル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 498.3 (MH⁺)

実施例 2235

25 1-(3-第 3 プチル-4-メトキシ-5-チアゾール-2-イル-フェニル)-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水

素酸塩MS: m/e (ESI) 461. 3 (MH^+)

実施例 2236

6-[2-(3-第 3 プチル-4-メトキシ-5-チアゾール-2-イル-フェニル)-2-オキソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6, 7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 522. 4 (MH^+)

実施例 2237

2-{2-[3-(アセチル-メチル-アミノ)-5-第 3 プチル-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 509. 4 (MH^+)

実施例 2238

N-{3-第 3 プチル-5-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-1イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-N-メチル-アセトアミド; 臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 514. 4 (MH^+)

実施例 2239

N-{3-第 3 プチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-1イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-N-メチル-アセトアミド; 臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 486. 4 (MH^+)

実施例 2240

N-{3-第 3 プチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-N-メチル-アセトアミド; 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 449.4 (MH⁺)

実施例 2241

6-[2-[3-(アセチルメチルアミノ)-5-第3ブチル-4-メトキシフェニル]-2-オキソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

5

MS:m/e (ESI) 510.5 (MH⁺)

実施例 2242

2-[2-(3-第3ブチル-5-ジエチルアミノ-4-メトキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

10

MS:m/e (ESI) 508.0 (MH⁺)

実施例 2243

1-(3-第3ブチル-5-ジエチルアミノ-4-メトキシフェニル)-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

15

MS:m/e (ESI) 514.0 (MH⁺)

実施例 2244

1-(3-第3ブチル-5-ジエチルアミノ-4-メトキシフェニル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

20

MS:m/e (ESI) 486.0 (MH⁺)

実施例 2245

1-(3-第3ブチル-5-ジエチルアミノ-4-メトキシフェニル)-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-1H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

25

MS:m/e (ESI) 449.0 (MH⁺)

実施例 2246

2-[2-(3-第 3 プチル-5-ジエチルアミノ-4-メトキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

5 MS:m/e(ESI) 509. 1(MH⁺)

実施例 2247

6-[2-(3-第 3 プチル-5-ジエチルアミノ-4-メトキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

10 MS:m/e(ESI) 510. 1(MH⁺)

実施例 2248

2-{2-[3-第 3 プチル-5-(エチル-メチルアミノ)-4-メトキシフェニル]-2-オキソ-エチル}-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

15 MS:m/e(ESI) 493. 8(MH⁺)

実施例 2249

1-[3-第 3 プチル-5-(エチル-メチルアミノ)-4-メトキシフェニル]-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

20 MS:m/e(ESI) 499. 9(MH⁺)

実施例 2250

1-[3-第 3 プチル-5-(エチル-メチルアミノ)-4-メトキシフェニル]-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

25 MS:m/e(ESI) 471. 9(MH⁺)

実施例 2251

1-[3-第 3 プチル-5-(エチル-メチル-アミノ)-4-メトキシ-フェニル]-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 435. 0 (MH⁺)

5 実施例 2252

2-{2-[3-第 3 プチル-5-(エチル-メチル-アミノ)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 495. 0 (MH⁺)

10 実施例 2253

6-{2-[3-第 3 プチル-5-(エチル-メチル-アミノ)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 496. 0 (MH⁺)

15 実施例 2254

2-[2-(3-第 3 プチル-4-メトキシ-5-オキサゾール-5-イル-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 505. 3 (MH⁺)

20 実施例 2255

1-(3-第 3 プチル-4-メトキシ-5-オキサゾール-5-イル-フェニル)-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 510. 4 (MH⁺)

25 実施例 2256

1-(3-第 3 プチル-4-メトキシ-5-オキサゾール-5-イル-フェニル)-2-(7-フルオロ

-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 482. 3(MH⁺)

実施例 2257

5 1-(3-第3ブチル-4-メトキシ-5-オキサゾール-5-イルフェニル)-2-(2-シクロプロピルピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 445. 4(MH⁺)

実施例 2258

10 6-[2-(3-第3ブチル-4-メトキシ-5-オキサゾール-5-イルフェニル)-2-オキソエチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 506. 4(MH⁺)

実施例 2259

15 2-{2-[8-第3ブチル-4-(2-シアノ-エチル)-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサン-6-イル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソイントール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 517. 8(MH⁺)

実施例 2260

20 6-{2-[8-第3ブチル-4-(2-シアノ-エチル)-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサン-6-イル]-2-オキソ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 519. 0(MH⁺)

実施例 2261

25 3-{8-第3ブチル-6-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソイントール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサン-4-イ

ル}-プロピオニトリル;臭化水素酸塩MS:m/e(ESI) 495.0 (MH⁺)

実施例 2262

3-[8-第3ブチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソイソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-プロピオニトリル;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 523.0 (MH⁺)

実施例 2263

3-[8-第3ブチル-6-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-プロピオニトリル;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 485.0 (MH⁺)

実施例 2264

2-{2-[8-第3ブチル-4-(2-シアノ-エチル)-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル]-2-オキソ-エチル}-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソイソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 517.1 (MH⁺)

実施例 2265

メタンスルфон酸 2-第3ブチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソイソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 544.2 (MH⁺)

実施例 2266

メタンスルfon酸 2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソイソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ジメチルアミノ-フェニルエステル;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 550. 2 (MH^+)

実施例 2267

メタンスルfonyl acid 2-[3-*p*-tolyl-6-*tert*-methylamino-4-[2-(7-fluoro-1-imino-5,6-dimethyl-1*H*-indole-2-yl)-acetyl]-phenyl ester; Oxyanhydride salt

5 エステル;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 521. 3 (MH^+)

実施例 2268

メタンスルfonyl acid 2-[3-*p*-tolyl-4-[2-(2-cyclopropylpropyl-7-imino-5,7-dihydro-1*H*-indole-6-yl)-acetyl]-6-*tert*-methylamino-phenyl ester; Oxyanhydride salt

10 エステル;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 484. 9 (MH^+)

実施例 2269

メタンスルfonyl acid 2-[3-*p*-tolyl-6-*tert*-methylamino-4-[2-(5-ethoxy-1-imino-6-methylcalvamoyl-1*H*-indole-2-yl)-acetyl]-phenyl ester; Oxyanhydride salt

15 エステル;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 545. 2 (MH^+)

実施例 2270

メタンスルfonyl acid 2-[3-*p*-tolyl-6-*tert*-methylamino-4-[2-(3-ethoxy-7-imino-2-methylcalvamoyl-5,7-dihydro-1*H*-indole-6-yl)-acetyl]-phenyl ester; Oxyanhydride salt

20 エステル;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 546. 0 (MH^+)

実施例 2271

1-(3-[3-*p*-tolyl-4-methoxy-5-pyridinyl-4-yl-phenyl]-2-(5,6-dimethyl-1*H*-indole-2-yl)-ethanol; Oxyanhydride salt

25 素酸塩

MS: m/e (ESI) 520. 3 (MH^+)

実施例 2272

1-(3-第 3 プチル-4-メトキシ-5-ピリジン-4-イル-フェニル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

5 MS: m/e (ESI) 492. 2 (MH^+)

実施例 2273

1-(3-第 3 プチル-4-メトキシ-5-ピリジン-4-イル-フェニル)-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

10 MS: m/e (ESI) 455. 2 (MH^+)

実施例 2274

6-[2-(3-第 3 プチル-4-メトキシ-5-ピリジン-4-イル-フェニル)-2-オキソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

15 MS: m/e (ESI) 516. 3 (MH^+)

実施例 2275

2-[2-(3-第 3 プチル-5-ジメチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-7-フルオロ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

20 MS: m/e (ESI) 499. 2 (MH^+)

実施例 2276

1-(3-第 3 プチル-5-ジメチルアミノ-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

25 MS: m/e (ESI) 472. 0 (MH^+)

実施例 2277

6-[2-(3-第3ブチル-5-ジメチルアミノ-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 468.0 (MH⁺)

5 実施例 2278

2-[2-(3-第3ブチル-5-ジメチルアミノ-4-エトキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 493.8 (MH⁺)

10 実施例 2279

1-(3-第3ブチル-5-ジメチルアミノ-4-エトキシフェニル)-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 499.9 (MH⁺)

15 実施例 2280

1-(3-第3ブチル-5-ジメチルアミノ-4-エトキシフェニル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 471.9 (MH⁺)

20 実施例 2281

1-(3-第3ブチル-5-ジメチルアミノ-4-エトキシフェニル)-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 434.9 (MH⁺)

25 実施例 2282

2-[2-(3-第3ブチル-5-ジメチルアミノ-4-エトキシフェニル)-2-オキソ-エチ

ル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 495. 0 (MH^+)

実施例 2283

5 6-[2-(3-第3ブチル-5-ジメチルアミノ-4-エトキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 496. 0 (MH^+)

実施例 2284

10 メタンスルfonyl 酸 4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ジメチルアミノ-6-メトキシフェニルエステル;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 524. 3 (MH^+)

実施例 2285

15 メタンスルfonyl 酸 2-ジメチルアミノ-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-メトキシフェニルエステル;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 496. 3 (MH^+)

実施例 2286

20 メタンスルfonyl 酸 4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ジメチルアミノ-6-メトキシフェニルエステル;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 459. 3 (MH^+)

実施例 2287

25 メタンスルfonyl 酸 2-ジメチルアミノ-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-メトキ

シーフェニル エステル;臭化水素酸塩MS:m/e (ESI) 520. 3 (MH⁺)

実施例 2288

メタンスルfonyl acid 2-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバ
モイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-メトキシフェニル
エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 532. 0 (MH⁺)

実施例 2289

メタンスルfonyl acid 2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ
-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-メトキシフェニル エス
テル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 537. 0 (MH⁺)

実施例 2290

メタンスルfonyl acid 2-第3ブチル-4-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチル
カルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-メトキシフェ
ニル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 531. 0 (MH⁺)

実施例 2291

メタンスルfonyl acid 2-第3ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバ
モイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-メトキシ
フェニル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 533. 0 (MH⁺)

実施例 2292

メタンスルfonyl acid 2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ
-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-メトキシフェニル エス
テル;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 509. 0 (MH⁺)

実施例 2293

メタンスルfonyl acid 2-[2-(2-cyclopropyl-7-imino-5,7-dihydro-1H-pyrazin-6-yl)-acetyl]-6-methoxyphenyl ester;臭化水素酸塩

5

MS: m/e (ESI) 472. 0 (MH⁺)

実施例 2294

メタンスルfonyl acid 3-[2-(5-ethoxy-1-imino-6-methylcyclohex-1,3-dihydro-1H-indole-2-yl)-acetyl]-2-methoxyphenyl ester;臭化水素酸塩

10

MS: m/e (ESI) 532. 1 (MH⁺)

実施例 2295

メタンスルfonyl acid 3-[2-(5,6-dietoxycyclohex-1,3-dihydro-1H-indole-2-yl)-acetyl]-2-methoxyphenyl ester;臭化水素酸塩

15

MS: m/e (ESI) 537. 1 (MH⁺)

実施例 2296

メタンスルfonyl acid 3-[2-(5-dimethylamino-1-imino-6-methylcyclohex-1,3-dihydro-1H-indole-2-yl)-acetyl]-2-methoxyphenyl ester;臭化水素酸塩

20

MS: m/e (ESI) 531. 1 (MH⁺)

実施例 2297

メタンスルfonyl acid 3-[2-(3-ethoxy-7-imino-2-methylcyclohex-1,3-dihydro-1H-pyrazin-6-yl)-acetyl]-2-methoxyphenyl ester;臭化水素酸塩

25

MS: m/e (ESI) 533. 1 (MH⁺)

実施例 2298

メタンスルfonyl 酸 3-第 3 プチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル エステル;臭化水素酸塩

5 MS: m/e (ESI) 509. 0 (MH^+)

実施例 2299

メタンスルfonyl 酸 3-第 3 プチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル エステル;臭化水素酸塩

10 MS: m/e (ESI) 472. 0 (MH^+)

実施例 2300

2-{2-[3-第 3 プチル-5-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシフェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

15 MS: m/e (ESI) 523. 4 (MH^+)

実施例 2301

1-[3-第 3 プチル-5-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシフェニル]-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

20 MS: m/e (ESI) 528. 5 (MH^+)

実施例 2302

2-{2-[3-第 3 プチル-5-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシフェニル]-2-オキソ-エチル}-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

25 MS: m/e (ESI) 522. 5 (MH^+)

実施例 2303

6-{2-[3-第 3 プチル-5-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシフェニル]-2-オキソ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 524. 5 (MH^+)

5 実施例 2304

1-[3-第 3 プチル-5-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシフェニル]-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-1*H*-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 500. 4 (MH^+)

10 実施例 2305

1-[3-第 3 プチル-5-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシフェニル]-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-5H-ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 463. 4 (MH^+)

15 実施例 2306

2-{2-[3-ジメチルアミノ-5-(1-フルオロ-1-メチル-エチル)-4-メトキシフェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1*H*-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 485. 3 (MH^+)

20 実施例 2307

6-{2-[3-ジメチルアミノ-5-(1-フルオロ-1-メチル-エチル)-4-メトキシフェニル]-2-オキソ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 486. 4 (MH^+)

25 実施例 2308

1-[3-ジメチルアミノ-5-(1-フルオロ-1-メチル-エチル)-4-メトキシフェニ

ル]-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 462. 3 (MH⁺)

実施例 2309

5 2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-1-[3-ジメチルアミノ-5-(1-フルオロ-1-メチル-エチル)-4-メトキシ-フェニル]-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 490. 4 (MH⁺)

実施例 2310

10 2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-1-[3-ジメチルアミノ-5-(1-フルオロ-1-メチル-エチル)-4-メトキシ-フェニル]-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 425. 4 (MH⁺)

実施例 2311

15 6-ジメチルアミノ-2-{2-[3-ジメチルアミノ-5-(1-フルオロ-1-メチル-エチル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 484. 4 (MH⁺)

実施例 2312

20 2-{2-[3-第3ブチル-5-(2-ヒドロキシ-エチルアミノ)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 497. 4 (MH⁺)

実施例 2313

25 2-{2-[3-第3ブチル-5-(2-ヒドロキシ-エチルアミノ)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール

-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩MS:m/e (ESI) 496.4 (MH⁺)

実施例 2314

1-[3-第3ブチル-5-(2-ヒドロキシエチルアミノ)-4-メトキシフェニル]-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-1イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 502.4 (MH⁺)

実施例 2315

1-[3-第3ブチル-5-(2-ヒドロキシエチルアミノ)-4-メトキシフェニル]-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-1イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 474.4 (MH⁺)

実施例 2316

1-[3-第3ブチル-5-(2-ヒドロキシエチルアミノ)-4-メトキシフェニル]-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 437.4 (MH⁺)

実施例 2317

6-{2-[3-第3ブチル-5-(2-ヒドロキシエチルアミノ)-4-メトキシフェニル]-2-オキソ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 498.4 (MH⁺)

実施例 2318

2-{2-[3-第3ブチル-5-(3-ヒドロキシプロピルアミノ)-4-メトキシフェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-1イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 511. 5 (MH^+)

実施例 2319

2-[2-[3-第 3 プチル-5-(3-ヒドロキシ-プロピルアミノ)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソイン
5 ドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 510. 5 (MH^+)

実施例 2320

1-[3-第 3 プチル-5-(3-ヒドロキシ-プロピルアミノ)-4-メトキシ-フェニル]-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-
10 イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 516. 5 (MH^+)

実施例 2321

1-[3-第 3 プチル-5-(3-ヒドロキシ-プロピルアミノ)-4-メトキシ-フェニル]-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-
15 イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 488. 4 (MH^+)

実施例 2322

1-[3-第 3 プチル-5-(3-ヒドロキシ-プロピルアミノ)-4-メトキシ-フェニル]-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イ
20 ル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 451. 4 (MH^+)

実施例 2323

6-{2-[3-第 3 プチル-5-(3-ヒドロキシ-プロピルアミノ)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピ
25 リジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 512. 5 (MH^+)

実施例 2324

2-[2-(3-ジメチルアミノ-5-イミノ-4-メトキシ-1-オキソ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

5 MS: m/e (ESI) 522. 5 (MH^+)

実施例 2325

2-[2-(3-ジメチルアミノ-5-イソプロペニル-4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

10 MS: m/e (ESI) 465. 3 (MH^+)

実施例 2326

6-[2-(3-ジメチルアミノ-5-イソプロペニル-4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

15 MS: m/e (ESI) 466. 3 (MH^+)

実施例 2327

1-(3-ジメチルアミノ-5-イソプロペニル-4-メトキシ-フェニル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

20 MS: m/e (ESI) 442. 3 (MH^+)

実施例 2328

2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-2-イル)-1-(3-ジメチルアミノ-5-イソプロペニル-4-メトキシ-フェニル)-エタノン;臭化水素酸塩

25 MS: m/e (ESI) 470. 4 (MH^+)

実施例 2329

2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イ
ル)-1-(3-ジメチルアミノ-5-イソプロペニル-4-メトキシフェニル)-エタノン;
臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 405.4 (MH⁺)

5 実施例 2330

6-ジメチルアミノ-2-[2-(3-ジメチルアミノ-5-イソプロペニル-4-メトキシフェ
ニル)-2-オキソ-エチル]-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボ
ン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 464.4 (MH⁺)

10 実施例 2331

エチルカルバミン酸 2-第3ブチル-4-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチル
カルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-エトキシフ
ェニル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 538.4 (MH⁺)

15 実施例 2332

エチルカルバミン酸 2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ
-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-エトキシフェニル エス
テル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 544.4 (MH⁺)

20 実施例 2333

エチルカルバミン酸 2-第3ブチル-6-エトキシ-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ
-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル
エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 516.4 (MH⁺)

25 実施例 2334

エチルカルバミン酸 2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒ

ドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-エトキシフェニル エステル; 臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 479. 4 (MH⁺)

実施例 2335

5 エチルカルバミン酸 2-第 3 プチル-6-エトキシ-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル; 臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 539. 5 (MH⁺)

実施例 2336

10 エチルカルバミン酸 2-第 3 プチル-6-エトキシ-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル エステル; 臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 540. 5 (MH⁺)

実施例 2337

15 1-(3-第 3 プチル-5-ジメチルアミノ-4-ヒドロキシフェニル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 444. 4 (MH⁺)

実施例 2338

20 2-[2-(7-ジメチルアミノ-3, 3-ジメチル-2, 3-ジヒドロ-ベンゾフラン-5-イル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 465. 4 (MH⁺)

実施例 2339

25 2-(5, 6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-1-(7-ジメチルアミノ-3, 3-ジメチル-2, 3-ジヒドロ-ベンゾフラン-5-イル)-

エタノン;臭化水素酸塩MS: m/e (ESI) 470. 4 (MH^+)

実施例 2340

6-ジメチルアミノ-2-[2-(7-ジメチルアミノ-3, 3-ジメチル-2, 3-ジヒドロ-ベンゾ5 フラン-5-イル)-2-オキソ-エチル]-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール
-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩MS: m/e (ESI) 464. 4 (MH^+)

実施例 2341

6-[2-(7-ジメチルアミノ-3, 3-ジメチル-2, 3-ジヒドロ-ベンゾフラン-5-イル)-2-10 オキソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6, 7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3, 4-b]ピリジン
-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩MS: m/e (ESI) 466. 4 (MH^+)

実施例 2342

1-(7-ジメチルアミノ-3, 3-ジメチル-2, 3-ジヒドロ-ベンゾフラン-5-イル)-2-(7-15 フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-2-イル)-エ
タノン;臭化水素酸塩MS: m/e (ESI) 442. 4 (MH^+)

実施例 2343

2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イ20 ル)-1-(7-ジメチルアミノ-3, 3-ジメチル-2, 3-ジヒドロ-ベンゾフラン-5-イル)-エ
タノン;臭化水素酸塩MS: m/e (ESI) 405. 4 (MH^+)

実施例 2344

2-[2-(3, 3-ジメチル-7-メチルアミノ-2, 3-ジヒドロ-ベンゾフラン-5-イル)-2-オ25 キソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メ
チルアミド;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 451. 4 (MH^+)

実施例 2345

2-(5, 6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-1-(3, 3-ジメチル-7-メチルアミノ-2, 3-ジヒドロ-ベンゾフラン-5-イル)-エ

5 タノン;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 456. 4 (MH^+)

実施例 2346

6-ジメチルアミノ-2-[2-(3, 3-ジメチル-7-メチルアミノ-2, 3-ジヒドロ-ベンゾフ

ラン-5-イル)-2-オキソ-エチル]-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-

10 カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 450. 4 (MH^+)

実施例 2347

6-[2-(3, 3-ジメチル-7-メチルアミノ-2, 3-ジヒドロ-ベンゾフラン-5-イル)-2-オ

キソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6, 7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3, 4-b]ピリジン

15 -2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 452. 4 (MH^+)

実施例 2348

1-(3, 3-ジメチル-7-メチルアミノ-2, 3-ジヒドロ-ベンゾフラン-5-イル)-2-(7-フ

ルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタ

20 ノン;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 428. 4 (MH^+)

実施例 2349

2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イ

ル)-1-(3, 3-ジメチル-7-メチルアミノ-2, 3-ジヒドロ-ベンゾフラン-5-イル)-エ

25 タノン;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 391. 4 (MH^+)

実施例 2350

2-[2-[3-ジメチルアミノ-5-(1-ヒドロキシ-1-メチル-エチル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

5 MS:m/e(ESI) 483. 2 (MH+)

実施例 2351

6-[2-[3-ジメチルアミノ-5-(1-ヒドロキシ-1-メチル-エチル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

10 MS:m/e(ESI) 484. 2 (MH+)

実施例 2352

1-[3-ジメチルアミノ-5-(1-ヒドロキシ-1-メチル-エチル)-4-メトキシ-フェニル]-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

15 MS:m/e(ESI) 460. 2 (MH+)

実施例 2353

2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-1-[3-ジメチルアミノ-5-(1-ヒドロキシ-1-メチル-エチル)-4-メトキシ-フェニル]-エタノン;臭化水素酸塩

20 MS:m/e(ESI) 488. 3 (MH+)

実施例 2354

2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-1-[3-ジメチルアミノ-5-(1-ヒドロキシ-1-メチル-エチル)-4-メトキシ-フェニル]-エタノン;臭化水素酸塩

25 MS:m/e(ESI) 423. 3 (MH+)

実施例 2355

6-ジメチルアミノ-2-[2-[3-ジメチルアミノ-5-(1-ヒドロキシ-1-メチル-エチル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル]-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 482. 3 (MH⁺)

5 実施例 2356

6-エトキシ-2-[2-[3-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-5-イソプロピル-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル]-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 523. 2 (MH⁺)

10 実施例 2357

6-ジメチルアミノ-2-[2-[3-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-5-イソプロピル-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル]-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 522. 2 (MH⁺)

15 実施例 2358

3-エトキシ-6-[2-[3-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-5-イソプロピル-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル]-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸 メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 524. 3 (MH⁺)

20 実施例 2359

2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-1-[3-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-5-イソプロピル-4-メトキシ-フェニル]-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 500. 2 (MH⁺)

25 実施例 2360

2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イ

ル)-1-[3-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-5-イソプロピル-4-メトキシ-フェニル]-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 463. 3 (MH⁺)

実施例 2361

5 (1-{5-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-3-イソプロピル-2-メトキシ-フェニル}-ピペリジン-4-イル)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 564. 2 (MH⁺)

実施例 2362

10 (1-{5-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-3-イソプロピル-2-メトキシ-フェニル}-ピペリジン-4-イル)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 566. 2 (MH⁺)

実施例 2363

15 (1-{5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-3-イソプロピル-2-メトキシ-フェニル}-ピペリジン-4-イル)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 542. 2 (MH⁺)

実施例 2364

20 (1-{5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-3-イソプロピル-2-メトキシ-フェニル}-ピペリジン-4-イル)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 505. 2 (MH⁺)

実施例 2365

25 2-(2-{3-第3ブチル-4-メトキシ-5-[(2-メトキシ-エチル)-メチル-アミノ]-フェニル}-2-オキソ-エチル)-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドー

ル-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩MS:m/e(ESI) 525. 2 (MH⁺)

実施例 2366

2-(2-{3-第3ブチル-4-メトキシ-5-[(2-メトキシエチル)-メチルアミノ]-フェニル}-2-オキソエチル)-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 524. 3 (MH⁺)

実施例 2367

1-{3-第3ブチル-4-メトキシ-5-[(2-メトキシエチル)-メチルアミノ]-フェニル}-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-1イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 530. 3 (MH⁺)

実施例 2368

1-{3-第3ブチル-4-メトキシ-5-[(2-メトキシエチル)-メチルアミノ]-フェニル}-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-1イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 502. 2 (MH⁺)

実施例 2369

1-{3-第3ブチル-4-メトキシ-5-[(2-メトキシエチル)-メチルアミノ]-フェニル}-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 465. 3 (MH⁺)

実施例 2370

6-(2-{3-第3ブチル-4-メトキシ-5-[(2-メトキシエチル)-メチルアミノ]-フェニル}-2-オキソエチル)-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS: m/e (ESI) 526. 3 (MH^+)

実施例 2371

2-[2-[3-ジメチルアミノ-4-メトキシ-5-(1-メトキシ-1-メチル-エチル)-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

5

MS: m/e (ESI) 497. 2 (MH^+)

実施例 2372

6-[2-[3-ジメチルアミノ-4-メトキシ-5-(1-メトキシ-1-メチル-エチル)-フェニル]-2-オキソ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6, 7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

10

MS: m/e (ESI) 498. 2 (MH^+)

実施例 2373

1-[3-ジメチルアミノ-4-メトキシ-5-(1-メトキシ-1-メチル-エチル)-フェニル]-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

15

MS: m/e (ESI) 474. 1 (MH^+)

実施例 2374

2-(5, 6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-1-[3-ジメチルアミノ-4-メトキシ-5-(1-メトキシ-1-メチル-エチル)-フェニル]-エタノン; 臭化水素酸塩

20

MS: m/e (ESI) 502. 2 (MH^+)

実施例 2375

2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-1-[3-ジメチルアミノ-4-メトキシ-5-(1-メトキシ-1-メチル-エチル)-フェニル]-エタノン; 臭化水素酸塩

25

MS: m/e (ESI) 437. 2 (MH^+)

実施例 2376

6-ジメチルアミノ-2-[2-[3-ジメチルアミノ-4-メトキシ-5-(1-メトキシ-1-メチルエチル)-フェニル]-2-オキソ-エチル}-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 496. 2 (MH⁺)

実施例 2377

2-{2-[3-第3ブチル-5-(3,4-ジヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

10 MS:m/e (ESI) 539. 2 (MH⁺)

実施例 2378

1-[3-第3ブチル-5-(3,4-ジヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

15 MS:m/e (ESI) 544. 2 (MH⁺)

実施例 2379

2-{2-[3-第3ブチル-5-(3,4-ジヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

20 MS:m/e (ESI) 538. 2 (MH⁺)

実施例 2380

6-{2-[3-第3ブチル-5-(3,4-ジヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

25 MS:m/e (ESI) 540. 2 (MH⁺)

実施例 2381

1-[3-第3ブチル-5-(3,4-ジヒドロキシピロリジン-1-イル)-4-メトキシフェニル]-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 516. 2 (MH⁺)

5 実施例 2382

1-[3-第3ブチル-5-(3,4-ジヒドロキシピロリジン-1-イル)-4-メトキシフェニル]-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-1H-ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 479. 2 (MH⁺)

10 実施例 2383

2-{2-[3-第3ブチル-5-(3-ヒドロキシ-4-メトキシピロリジン-1-イル)-4-メトキシフェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 553. 1 (MH⁺)

15 実施例 2384

1-[3-第3ブチル-5-(3-ヒドロキシ-4-メトキシピロリジン-1-イル)-4-メトキシフェニル]-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 558. 1 (MH⁺)

20 実施例 2385

2-{2-[3-第3ブチル-5-(3-ヒドロキシ-4-メトキシピロリジン-1-イル)-4-メトキシフェニル]-2-オキソ-エチル}-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 552. 2 (MH⁺)

25 実施例 2386

6-{2-[3-第3ブチル-5-(3-ヒドロキシ-4-メトキシピロリジン-1-イル)-4-メト

キシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 554. 2 (MH+)

実施例 2387

5 1-[3-第3ブチル-5-(3-ヒドロキシ-4-メトキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 530. 2 (MH+)

実施例 2388

10 1-[3-第3ブチル-5-(3-ヒドロキシ-4-メトキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 493. 2 (MH+)

実施例 2389

15 2-{2-[3-第3ブチル-5-(シアノメチル-メチルアミノ)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 506. 2 (MH+)

実施例 2390

20 6-{2-[3-第3ブチル-5-(シアノメチル-メチルアミノ)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 507. 2 (MH+)

実施例 2391

25 ({3-第3ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-メチルアミノ)-アセ

トニトリル;臭化水素酸塩MS:m/e(ESI) 483.2(MH⁺)

実施例 2392

({3-第 3 プチル-5-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル}-メチル-アミノ)-アセトニトリル;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 511.3(MH⁺)

実施例 2393

({3-第 3 プチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル}-メチル-アミノ)-アセトニトリル;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 446.2(MH⁺)

実施例 2394

2-{2-[3-第 3 プチル-5-(シアノメチル-メチル-アミノ)-4-メトキシフェニル]-2-オキソ-エチル}-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 505.2(MH⁺)

実施例 2395

2-{2-[3-第 3 プチル-5-(シアノメチル-アミノ)-4-メトキシフェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 492.2(MH⁺)

実施例 2396

6-{2-[3-第 3 プチル-5-(シアノメチル-アミノ)-4-メトキシフェニル]-2-オキソ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6, 7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 493. 2 (MH⁺)

実施例 2397

{3-第3ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニルアミノ}-アセトニトリル;

5 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 469. 2 (MH⁺)

実施例 2398

{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニルアミノ}-アセトニトリル;

10 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 497. 2 (MH⁺)

実施例 2399

{3-第3ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニルアミノ}-アセトニトリル;臭

15 化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 432. 2 (MH⁺)

実施例 2400

2-{2-[3-第3ブチル-5-(シアノメチル-アミノ)-4-メトキシフェニル]-2-オキソ-エチル}-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カル

20 ボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 491. 2 (MH⁺)

実施例 2401

2-{2-[3-第3ブチル-5-(4-ヒドロキシ-4-メチル-ピペリジン-1-イル)-4-メトキシフェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソイ

25 ンドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 551. 3 (MH⁺)

実施例 2402

2-[2-[3-第 3 プチル-5-(4-ヒドロキシ-4-メチルピペリジン-1-イル)-4-メトキシフェニル]-2-オキソ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

5 MS:m/e(ESI) 550. 3 (MH⁺)

実施例 2403

6-[2-[3-第 3 プチル-5-(4-ヒドロキシ-4-メチルピペリジン-1-イル)-4-メトキシフェニル]-2-オキソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

10 MS:m/e(ESI) 552. 3 (MH⁺)

実施例 2404

1-[3-第 3 プチル-5-(4-ヒドロキシ-4-メチルピペリジン-1-イル)-4-メトキシフェニル]-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

15 MS:m/e(ESI) 528. 2 (MH⁺)

実施例 2405

6-エトキシ-3-イミノ-2-[2-(3-イソプロピル-4-メトキシ-5-モルフォリン-4-イル)フェニル]-2-オキソ-エチル]-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

20 MS:m/e(ESI) 509. 2 (MH⁺)

実施例 2406

6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2-[2-(3-イソプロピル-4-メトキシ-5-モルフォリン-4-イル)フェニル]-2-オキソ-エチル]-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

25 MS:m/e(ESI) 508. 2 (MH⁺)

実施例 2407

2-(5, 6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イ
ル)-1-(3-イソプロピル-4-メトキシ-5-モルフォリン-4-イル-フェニル)-エタノ
ン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 514. 2 (MH⁺)

5 実施例 2408

2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イ
ル)-1-(3-イソプロピル-4-メトキシ-5-モルフォリン-4-イル-フェニル)-エタノ
ン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 486. 2 (MH⁺)

10 実施例 2409

2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イ
ル)-1-(3-イソプロピル-4-メトキシ-5-モルフォリン-4-イル-フェニル)-エタノ
ン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 449. 2 (MH⁺)

15 実施例 2410

3-エトキシ-7-イミノ-6-[2-(3-イソプロピル-4-メトキシ-5-モルフォリン-4-イ
ル-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6, 7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-2-カ
ルボン酸 メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 510. 2 (MH⁺)

20 実施例 2411

2-(2-{3-第3ブチル-5-[エチル-(2-ヒドロキシ-エチル)-アミノ]-4-メトキシ-フ
エニル}-2-オキソ-エチル)-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインド
ール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 525. 2 (MH⁺)

25 実施例 2412

2-(2-{3-第3ブチル-5-[エチル-(2-ヒドロキシ-エチル)-アミノ]-4-メトキシ-フ
エニル}-2-オキソ-エチル)-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインド
ール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

エニル}-2-オキソ-エチル)-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソ
インドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 524. 2 (MH⁺)

実施例 2413

5 1-{3-第3ブチル-5-[エチル-(2-ヒドロキシ-エチル)-アミノ]-4-メトキシフェニル}-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 530. 2 (MH⁺)

実施例 2414

10 1-{3-第3ブチル-5-[エチル-(2-ヒドロキシ-エチル)-アミノ]-4-メトキシフェニル}-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 502. 2 (MH⁺)

実施例 2415

15 1-{3-第3ブチル-5-[エチル-(2-ヒドロキシ-エチル)-アミノ]-4-メトキシフェニル}-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 465. 2 (MH⁺)

実施例 2416

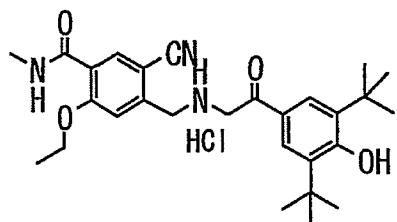
20 6-(2-{3-第3ブチル-5-[エチル-(2-ヒドロキシ-エチル)-アミノ]-4-メトキシフェニル}-2-オキソ-エチル)-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e(ESI) 526. 2 (MH⁺)

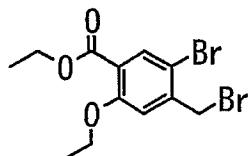
25 以下の実施例化合物は、上記各種1-イミノイソインドリン誘導体の開環型のプロドラッグ体として合成した。

<実施例 2417>

N1-メチル-5-シアノ-4-[(1-{2-[3,5-ジ(第3ブチル)-4-ハイドロキシフェニル]-2-オキソエチル}アミノ)メチル]-2-エトキシベンズアミド；塩酸塩



5 (工程 1) エチル 5-ブロモ-4-(ブロモメチル)-2-エトキシベンゾエイト

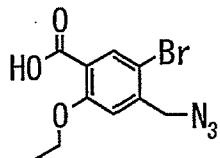


エチル 5-ブロモ-2-エトキシ-4-メチルベンゾエイト 19.72g を四塩化炭素に溶解しアゾビスイソブチロニトリル(1.13g)を加え、30 分間加熱還流した。N-ブロモスクシンイミドを加え、さらに1時間加熱還流した。反応液を濾過し、濾液を濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶媒：n-ヘキサン-酢酸エチル)にて精製し、標記化合物 10.54g を無色油状物として得た。

1H-NMR (CDCl₃) δ (ppm)

1.37 (3H, t, J=7.2Hz), 1.46 (3H, t, J=7.2Hz), 4.11 (2H, q, J=7.2Hz), 4.35 (2H, q, J=7.2Hz), 4.54 (2H, s), 7.04 (1H, s), 7.94 (1H, s)

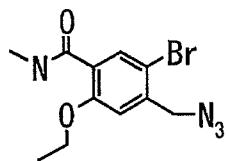
15 (工程 2) 4-(アジドメチル)-5-ブロモ-2-エトキシ安息香酸



エチル 5-ブロモ-4-(ブロモメチル)-2-エトキシベンゾエイト 7.807g をジメチルホルムアミド(50ml)に溶解し、アジ化ナトリウム(2.0g)を加えた。室温にて終夜攪拌した。反応液を酢酸エチルに希釈し水、1N-塩酸、飽和食塩水にて洗浄し、有機層を無水硫酸マグネシウムにて乾燥、濾過、濃縮し、淡黄色油状物 6.96gを得た。このものをエタノール(100ml)に溶解し、5N-水酸化ナトリウムを加え 50°C にて 1 時間攪拌した。5N-塩酸(5ml)にて中和し、酢酸エチルにて抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムにて乾燥、濾過、濃縮し、淡黄色油状物 7.60gを得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δ (ppm)

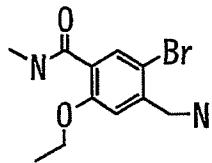
10 1.59 (3H, t, J=6.8Hz), 4.37 (2H, q, J=6.8Hz), 4.57 (2H, s), 7.14 (1H, s), 8.37 (1H, s)
(工程 3) N1-メチル-4-(アジドメチル)-5-ブロモ-2-エトキシベンズアミド



4-(アジドメチル)-5-ブロモ-2-エトキシベンゾイック アシッド 7.67g をテトラヒドロフラン(100ml)に溶解し、トリエチルアミン(3.2ml)、クロロギ酸エチル(2.11ml)を順次加え室温にて 30 分攪拌した。メチルアミン水溶液(3.2ml)を加え、室温 30 分攪拌した。酢酸エチルにて希釈し水、1N-塩酸にて洗浄し有機層を無水硫酸マグネシウムにて乾燥、濾過、濃縮し標記化合物 5.328g を白色固体を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δ (ppm)

15 1.53 (3H, t, J=6.8Hz), 3.00 (3H, d, J=4.8Hz), 4.23 (2H, q, J=7.2Hz), 4.51 (2H, s), 7.01 (1H, s), 7.88 (1H, br), 8.40 (1H, s)
(工程 4) N1-メチル-4-(アミノメチル)-5-ブロモ-2-エトキシベンズアミド

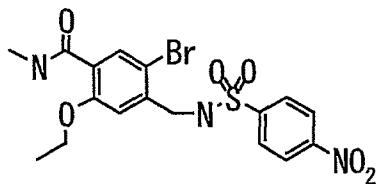


N1-メチル-4-(アジドメチル)-5-ブロモ-2-エトキシベンズアミド 5.32g をテトラヒドロフラン(50ml)、水(3ml)に溶解し、トリフェニルfosfin(5.4g)を加えた。室温にて4日間攪拌した。反応液を濃縮し残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶媒:n-ヘキサン-酢酸エチル)にて精製し、
5 標記化合物 5.11g を淡黄色固体として得た。

¹H-NMR(CDCl₃) δ (ppm)

1.38(3H, t, J=7.2Hz), 2.79(3H, d, J=4.8Hz), 3.71(2H, s), 4.20(2H, q, J=7.2Hz), 7.34
(1H, s), 7.84(1H, s), 8.03(1H, br)

10 (工程5) N1-メチル-5-ブロモ-2-エトキシ-4-([(4-ニトロフェニル)スルフォニル]アミノ)メチル)ベンズアミド



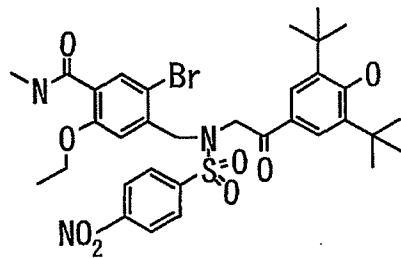
N1-メチル-4-(アミノメチル)-5-ブロモ-2-エトキシベンズアミド (6.77g) をピリジン(50ml)に溶解し、4-ニトロベンゼンスルフォニルクロリド(5.3g)を加えた。
15 室温にて終夜攪拌した。水、酢酸エチルを加え分液した。有機層を1N-塩酸、飽和食塩水にて順次洗浄し、析出した結晶を濾取した。(5.57g)濾液を有機層を無水硫酸マグネシウムにて乾燥、濾過、濃縮し、残渣を酢酸エチルにて洗浄、濾取し、標記化合物をあわせて 8.31g を白色固体として得た。

¹H-NMR(CDCl₃) δ (ppm)

20 1.34(3H, t, J=9.2Hz), 2.76(3H, d, J=4.4Hz), 4.03(2H, q, J=7.2Hz), 4.16(2H, d, J=6.4

Hz), 7.03(1H, s), 7.75(1H, s), 7.96–8.02(1H, m), 7.98(2H, d, J=11.6Hz), 8.34(2H, d, J=11.6Hz), 8.66–8.72(1H, m)

(工程6) N1-メチル-5-ブロモ-4-({{2-[3,5-ジ(第3ブチル)-4-ハイドロキシフェニル]-2-オキソエチル}[(4-ニトロフェニル)スルフォニル]アミノ}メチル)-2-
 5 エトキシベンズアミド

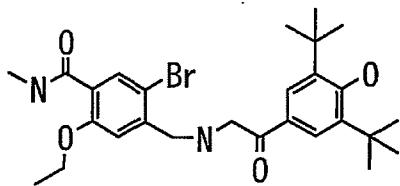


N1-メチル-5-ブロモ-2-エトキシ-4-([(4-ニトロフェニル)スルフォニル]アミノ}メチル)ベンズアミド(2.10g)をアセトニトリル(20ml)に懸濁し、2-ブロモ-1-[3,5-ジ(第3ブチル)-4-ヒドロキシフェニル]-1-エタノン(1.74g)、炭酸セシウム(1.74g)を順次加えた。室温にて3日間攪拌し、酢酸エチルにて希釈、水、1N-10 塩酸にて洗浄した。有機層を無水硫酸マグネシウムにて乾燥、濾過、濃縮し、残渣を酢酸エチル-ジイソプロピルエーテルにて洗浄、濾取し、標記化合物3.04gを白色固体として得た。

1H-NMR(CDCl₃) δ (ppm)

15 1.43(18H, s), 1.51(3H, t, J=6.8Hz), 3.00(3H, d, J=4.8Hz), 4.18(2H, q, J=6.8Hz), 4.65(2H, s), 4.72(2H, s), 5.82(1H, s), 7.28(1H, s), 7.61(2H, s), 7.83–7.89(1H, m), 8.05(2H, d, J=11.6Hz), 8.32(1H, s), 8.37(2H, d, J=9.2Hz)

(工程7) N1-メチル-5-ブロモ-4-[(2-[3,5-ジ(第3ブチル)-4-ハイドロキシフェニル]-2-オキソエチル]アミノ}メチル]-2-エトキシベンズアミド

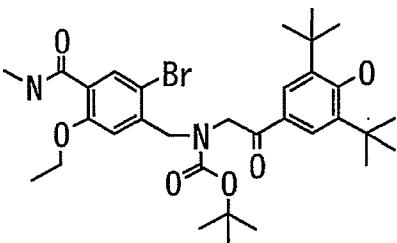


チオフェノール(1.27ml)をジメチルホルムアミド(20ml)に溶解し、水素化ナトリウム(480mg)を加えた。室温30分攪拌し、N1-メチル-5-ブロモ-4-[(2-[3,5-ジ(第3ブチル)-4-ハイドロキシフェニル]-2-オキソエチル][(4-ニトロフェニル)スルフォニル]アミノ}メチル)-2-エトキシベンズアミド(2.95g)を加えた。室温にて1時間攪拌し、酢酸エチルにて希釈、水、飽和食塩水にて洗浄し、有機層を無水硫酸マグネシウムにて乾燥、濾過、濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶媒:n-ヘキサン-酢酸エチル)にて精製し、標記化合物1.75gを淡橙色油状物として得た。(收率78%)

10 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ (ppm)

1.42(18H, s), 1.48(3H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 2.99(3H, d, $J=4.8\text{Hz}$), 4.31(2H, q, $J=6.8\text{Hz}$), 4.36(2H, s), 4.42(2H, s), 5.86(1H, s), 7.73(2H, s), 7.75(1H, s), 7.93(1H, brs), 8.39(1H, d, $J=3.6\text{Hz}$)

(工程8)第3ブチル N-{2-ブロモ-5-エトキシ-4-[(メチルアミノ)カルボニル]ベンジル}-N-{2-[3,5-ジ(第3ブチル)-4-ハイドロキシフェニル]-2-オキソエチル}カーバメイト



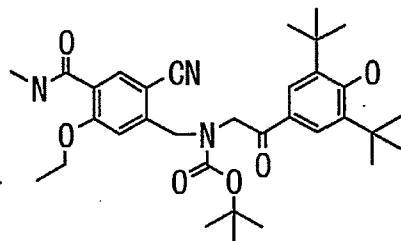
N1-メチル-5-ブロモ-4-[(2-[3,5-ジ(第3ブチル)-4-ハイドロキシフェニル]-2-オキソエチル)アミノ]メチル)-2-エトキシベンズアミド(1.75g)をテトラヒドロ

フラン(20ml)に溶解し第三ブチルジカーボネート(770mg)を加えた。2時間加熱還流し、反応液を濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶媒:n-ヘキサン-酢酸エチル)にて精製し、標記化合物 1.97g を白色固体として得た。

¹H-NMR(CDCl₃) δ (ppm)

5 1.42, 1.44, 1.46 (27H, each s), 1.50 (3H, t, J=7.2Hz), 3.00, 3.02 (3H, each d, J=4.8Hz and J=5.2Hz), 4.15, 4.23 (2H, each q, J=7.2Hz and 6.8Hz), 4.56, 4.57 (2H, each s), 4.63, 4.67 (2H, each s), 5.75 (1H, s), 7.12, 7.29 (1H, s), 7.72, 7.80 (2H, each s), 7.87-7.94 (1H, m), 8.32, 8.35 (1H, each s)

10 (工程9)第3ブチル N-{2-シアノ-5-エトキシ-4-[（メチルアミノ）カルボニル]ベンジル}-N-{2-[3,5-ジ(第3ブチル)-4-ハイドロキシフェニル]-2-オキソエチル}カーバメイト



15 第3ブチル N-{2-ブロモ-5-エトキシ-4-[（メチルアミノ）カルボニル]ベンジル}-N-{2-[3,5-ジ(第3ブチル)-4-ハイドロキシフェニル]-2-オキソエチル}カーバメイト(2.71g)をプロピオニトリル(11ml)に溶解し、窒素雰囲気下、シアノ化ナトリウム(420mg)、よう化銅(163mg)、テトラキストリフェニルfosfinパラジウム(495mg)、を加え1時間加熱還流した。よう化銅(170mg)、テトラキストリフェニルfosfinパラジウム(500mg)を追加し更に4時間加熱還流した。反応液に酢酸エチル、水を加えセライト濾過した。濾液を、水、飽和食塩水で洗浄した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥し、不溶物を濾別後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶媒:n-ヘキサン-酢酸エチル)にて精製し、標記化合物 788mg を白色固体として得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δ (ppm)

1.38, 1.41, 1.45 (18H, each s), 1.54 (3H, t, J=6.8Hz), 1.57 (9H, s), 3.00, 3.01 (3H, each s), 4.29, 4.36 (2H, each s), 4.71, 4.75 (2H, each s), 5.76 (1H, s), 7.47, 7.51 (1H, each s), 7.72, 7.82 (2H, each s), 7.76-7.82 (1H, m), 8.46, 8.50 (1H, each s)

(実施例 2417 : 最終工程)

第3ブチル N-{2-シアノ-5-エトキシ-4-[（メチルアミノ）カルボニル]ベンジル}-N-{2-[3,5-ジ(第3ブチル)-4-ハイドロキシフェニル]-2-オキソエチル}カーバメイト (454mg) を 4N-塩化水素-ジオキサン溶液に溶解し、室温にて 1 時間攪拌した。反応液を濃縮し、目的化合物 410mg を白色固体として得た。

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ (ppm)

1.39 (3H, t, J=6.8Hz), 1.40 (18H, s), 2.79 (3H, d, J=3.6Hz), 4.28 (2H, q, J=6.8Hz), 4.38 (2H, brs), 4.89 (2H, brs), 7.74 (2H, s), 7.81 (1H, s), 8.04 (1H, s), 8.14 (1H, s), 8.17 (1H, d, J=4.8Hz)

実施例 2418

5-ブロモ-4-{[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキソ-エチルアミノ]-メチル}-2-エトキシ-3-フルオロ-N-メチル-ベンズアミド

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.40 (3H, t, J=7.2Hz), 1.45 (18H, s), 3.00 (3H, d, J=4.8Hz), 4.12 (4H, s), 4.20 (2H, q, J=7.2Hz), 5.76 (1H, s), 7.76 (2H, s), 7.82 (1H, br), 8.12 (1H, s).

実施例 2419

5-シアノ-4-{[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキソ-エチルアミノ]-メチル}-2-エトキシ-3-フルオロ-N-メチル-ベンズアミド

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.31 (3H, t, J=7.2Hz), 1.41 (18H, s), 2.78 (3H, t, J=4.4Hz), 4.27 (2H, q, J=7.2Hz), 4.3

6(2H, brs), 4.89(2H, brs), 7.75(2H, s), 8.13(1H, s), 8.38-8.42(1H, m).

実施例 2420

5-シアノ-4-{[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキソ-エチルアミノ]-メチル}-2-エトキシ-N-メチルベンズアミド; 塩酸塩

5 1H-NMR(DMSO-d6) δ :

1.39(3H, t, J=6.8Hz), 1.40(18H, s), 2.79(3H, d, J=3.6Hz), 4.28(2H, q, J=6.8Hz), 4.38(2H, brs), 4.89(2H, brs), 7.74(2H, s), 7.81(1H, s), 8.04(1H, s), 8.14(1H, s), 8.17(1H, d, J=4.8Hz).

実施例 2421

10 4-{((2-アミノ-アセチル)-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-アミノ}-メチル}-5-シアノ-2-エトキシ-N-メチルベンズアミド; 塩酸塩

1H-NMR(DMSO-d6) δ :

1.36(3H, t, J=7.2Hz), 1.40(9H, s), 2.77(3H, d, J=4.8Hz), 4.22(2H, q, J=7.2Hz), 4.46(2H, brs), 4.87(2H, brs), 5.20(2H, brs), 7.12(1H, s), 7.76(2H, s), 8.03(1H, s), 8.05-8.12(1H, m), 8.25(1H, br).

実施例 2422

5-シアノ-4-({[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-メチル-アミノ}-メチル)-2-エトキシ-N-メチルベンズアミド

20 1H-NMR(DMSO-d6) δ :

1.33(3H, t, J=7.2Hz), 1.37(18H, s), 2.36(3H, s), 2.77(3H, d, J=4.4Hz), 3.86(2H, s), 3.98(2H, s), 4.10(2H, q, J=7.2Hz), 7.25(1H, s), 7.70(2H, s), 7.78(1H, brs), 7.93(1H, s), 8.03-8.07(1H, m).

実施例 2423

25 {2-第3ブチル-4-[2-(2-シアノ-5-エトキシ-4-メチルカルバモイル-ベンジルアミノ)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸メチルエステル; 塩酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 31 (9H, s), 1. 38 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 76 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 25 (2H, d, J=7. 2Hz), 3. 70 (3H, s), 4. 19-4. 30 (2H, m), 4. 93 (2H, d, J=6. 4Hz), 5. 41 (1H, br), 6. 91 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 37 (1H, s), 7. 67 (1H, d, J=2. 4Hz), 7. 80 (1H, dd, J=2. 0, 8. 8Hz), 7. 82 (1H, s), 7. 98-8. 01 (1H, m), 8. 56 (2H, br).

5 実施例 2424

5-シアノ-4-({[2-(3,5-ジ-第 3 プチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-メチル-アミノ}-メチル)-2-エトキシ-ベンズアミド

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

10 1. 34 (3H, t, J=6. 4Hz), 1. 37 (9H, s), 2. 36 (3H, s), 3. 86 (2H, s), 3. 97 (2H, s), 4. 09 (2H, q, J=6. 4Hz), 7. 25 (1H, s), 7. 54 (1H, br), 7. 69 (2H, s), 7. 71 (1H, br), 7. 78 (1H, br), 7. 99 (1H, s).

実施例 2425

4-[({2-[3-第 3 プチル-5-(3-カルバモイル-プロポキシ)-4-ヒドロキシフェニル]-2-オキソ-エチル}-メチル-アミノ)-メチル]-5-シアノ-2-エトキシ-N-メチル-ベンズアミド

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 34 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 36 (9H, s), 1. 97 (2H, quint, J=6. 8Hz), 2. 29 (2H, t, J=6. 8Hz), 2. 35 (3H, s), 2. 79 (3H, d, J=4. 4Hz), 3. 88 (2H, s), 4. 00 (4H, m), 4. 12 (2H, q, J=7. 2Hz), 6. 83 (1H, s), 7. 28 (1H, s), 7. 33 (1H, s), 7. 37 (1H, s), 7. 48 (1H, s), 7. 96 (1H, s), 8. 08 (1H, q, J=4. 4Hz), 9. 16 (1H, s).

実施例 2426

4-[({2-[3-第 3 プチル-5-(3-カルバモイル-プロポキシ)-4-ヒドロキシフェニル]-2-オキソ-エチル}-メチル-アミノ)-メチル]-5-シアノ-2-エトキシ-ベンズアミド

25 1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1.36(12H, m), 1.98(2H, quint, J=7.2Hz), 2.29(2H, t, J=7.2Hz), 2.36(3H, s), 3.88(2H, s), 4.00(4H, m), 4.12(2H, q, J=6.8Hz), 6.83(1H, s), 7.29(1H, s), 7.33(1H, s), 7.37(1H, s), 7.47(1H, s), 7.57(1H, s), 7.73(1H, s), 8.01(1H, s), 9.16(1H, s).

実施例 2427

5 4-(3-第3ブチル-5-[2-[(2-シアノ-5-エトキシ-ベンジル)-メチル-アミノ]-アセチル}-2-ヒドロキシフェノキシ)-ブチルアミド

1H-NMR(DMSO-d6) δ :

1.29(3H, t, J=7Hz), 1.34(9H, s), 1.92-2.01(2H, m), 2.45-2.55(2H, m), 2.55(3H, s), 3.92-4.06(4H, m), 4.15(2H, q, J=7Hz), 5.38(2H, s), 7.18-7.42(2H, m), 7.45-7.66(2H, m), 7.68-7.82(2H, m).

実施例 2428

4-(2-[3-第3ブチル-5-(3-カルバモイル-プロポキシ)-4-ヒドロキシフェニル]-2-オキソ-エチルアミノ)-メチル-5-シアノ-2-エトキシ-N-メチル-ベンズアミド; 塩酸塩

15 1H-NMR(DMSO-d6) δ :

1.38(9H, s), 1.40(3H, t, J=6.8Hz), 1.99(2H, t, J=6.8Hz), 2.29(2H, t, J=6.8Hz), 2.79(3H, d, J=4.8Hz), 4.05(2H, t, J=6.4Hz), 4.29(2H, q, J=6.8Hz), 4.38(2H, brs), 4.88(2H, brs), 6.81(1H, brs), 7.36(1H, brs), 7.42(1H, s), 7.48(1H, s), 7.86(1H, s), 8.03(1H, s), 8.18(1H, q, J=3.6Hz), 9.51(1H, brs).

20 試験例

本発明の化合物およびその塩の生化学的活性および医薬としての作用効果（トロンビン受容体結合能、血小板凝集抑制作用、平滑筋細胞の増殖抑制作用）を、以下の方法により評価した。

<試験例 1>

25 [レセプターバインディングアッセイ]

1週間以内に薬物を服用していない健常人より採血を行い、凝固阻止剤として

3.8%クエン酸（血液 9 に対して 1 の割合）を添加した。室温下、100g で 10 分間遠心することで多血小板血漿（PRP : platelet rich plasma）を得た。PRP を遠心して得た血小板沈渣を Dounce homogenizer でホモジナイズし、40,000g で 60 分間遠心し血小板膜を得た。得られた血小板膜は、10 mM MgCl₂ と 1 mM EGTA（エチレンジリコール四酢酸）を含む 50 mM トリス塩酸緩衝液（緩衝液 1）に 1%の濃度になるように DMSO（ジメチルスルホキサイド）を添加した溶液で懸濁し、-80°C で保存した。緩衝液 1 にウシアルブミンおよび DMSO をそれぞれ 0.1%および 20%となるように添加して、被検化合物の調製液とした。この調製液で種々の濃度に希釈した被検化合物（20 μl）を 96 穴のマルチスクリーンプレートに添加した。

その後、緩衝液 1 にて希釈した 25 nM の [³H]Ala-(4-fluoro)Phe-Arg-(cyclohexyl)Ala-(homo)Arg-Tyr-NH₂ (high affinity TRAP) 80 μl を添加して良く混和した。さらに、あらかじめ調製しておいた血小板膜溶液（0.4 mg/ml）100 μl を添加して混和した後、37 °C で 1 時間インキュベーションした。反応液を吸引濾過後に、200 μl の緩衝液 1 にて三回洗浄した。その後、液体シンチレーター 30 μl を添加してトップカウンター（パックカード）によりプレートの放射活性を測定し、被検化合物存在時の放射活性から非特異的結合分を差し引いた値を、特異的結合値（化合物非存在時の結合から非特異的結合分を差し引いた値）で除することにより結合率を求め、IC₅₀ 値を算出した。なお、非特異的な結合は 10 μM の high affinity TRAP を添加した値とした。得られた結果を表 1～表 4 に示す。

20 <試験例 2>

[多血小板血漿を利用した血小板凝集抑制作用]

1 週間以内に薬物を服用していない健常人より採血を行い、凝固阻止剤として 3.8%クエン酸（血液 9 に対して 1 の割合）を添加した。室温下、100g で 10 分間遠心することで多血小板血漿（PRP : platelet rich plasma）を得た。PRP を除去した血液をさらに 1000g で 10 分間遠心することで乏血小板血漿（PPP : platelet poor plasma）を得た。血小板数は、多項目自動血球計数装置（K4500、シスメッ

クス)で測定し、約30万/ μ lとなるようにPRPをPPPで希釈した。血小板凝集能は、アグリゴメーター(エムシーメディカル)を用いて次のようにして調べた。PRP(175 μ l)にFibrin重合阻止剤としてGPRP-NH₂(最終濃度1mM、25 μ l)を添加し、さらにCa非含有タイロード液(コントロール)あるいは種々の濃度の被検化合物溶液(25 μ l)を添加して37°Cで3分間保温した後、25 μ lの最大凝集を引き起こす最小濃度のトロンビン(最終濃度:0.5~1.5units/mlのうちの至適濃度)を加え血小板凝集を惹起した。実験によっては、PRPとCa非含有タイロード液(コントロール)あるいは種々の濃度の検体調製液をあらかじめ37°Cで60分間プレインキュベーションを行った後、血小板凝集の反応を行った。トロンビン添加後、6分間の凝集反応を調べ、凝集曲線の曲線下面積を比較することにより抑制率を求め、IC₅₀値を算出した。得られた結果を表1~表4に示す。

<試験例3>

[ラット平滑筋細胞増殖アッセイ]

雄性SDラット大動脈からexplant法にて血管平滑筋細胞(rSMC)を単離した。増殖培地には、10%の牛胎児血清(GibcoBRL)、ストレプトマイシンおよびペニシリンを含むDMEM培地(Sigma)を用い、37°C、5%CO₂存在下で継代培養した。増殖培地にて1×10⁴cells/mlの濃度に懸濁したrSMC100 μ lを96穴プレートに加え培養を開始した。三日後にDMEM培地100 μ lにて二回洗浄した後、培地を0.1%アルブミンを含むDMEM培地(飢餓培地)100 μ lに交換して血清飢餓を開始した。血清飢餓二日後に培地を交換し、飢餓培地80 μ lおよび飢餓培地にて種々の濃度に希釈した被検化合物の10 μ lを添加し、さらに飢餓培地で溶解したトロンビン(最終濃度0.1units/ml)10 μ lを添加してさらに2日間インキュベーションした。

7.5mg/mlとなるようにDPBSで溶解したMTT(3-[4,5-dimethylthiazol-2-yl]-2,5-diphenyl-tetrazolium bromide)を20 μ l添加し、さらに4時間インキュベーションを行った。培地を吸引除去して50 μ lの10%SDS/0.029%ammonia溶液

を添加して CO₂ インキュベーター内で 2 時間静置して細胞を完全に溶解した。細胞増殖の指標として OD590nm をプレートリーダー (EL340、BIO-TEK instruments Inc.) で測定し、コントロールOD値（化合物非存在時のOD値）から被検化合物存在時のOD値を差し引いた値を、コントロールOD値からブランクOD値(トロンビン非刺激でのOD値) を差し引いた値で除することにより抑制率を求め、IC₅₀ 値を算出した。得られた結果を表 1 ~ 表 4 に示す。

5

表 1

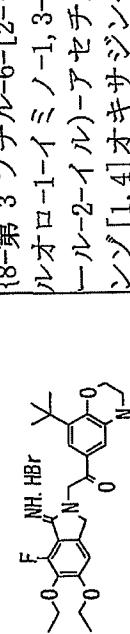
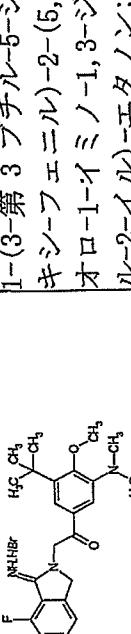
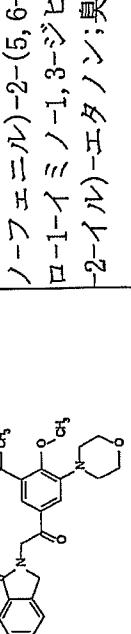
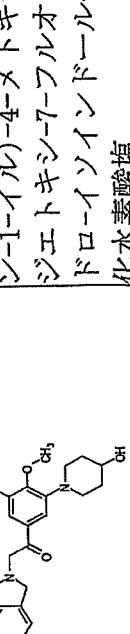
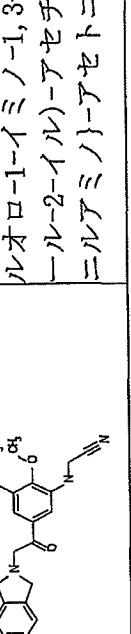
実施例 No.	化合物	化合物名	RBA IC ₅₀ (μ M)	Thr IC ₅₀ (μ M)	Rat SMC IC ₅₀ (μ M)
実施例 5		{8-第3ブチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-エチル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベニゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-アセトニトリル;臭化水素酸塩	0.017	0.29	0.0061
実施例 6		1-(3-第3ブチル-5-ジメチルアミノ-4-メトキシフェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩	0.024	0.072	0.019
実施例 7		1-(3-第3ブチル-4-メトキシ-5-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩	0.026	0.041	0.032
実施例 8		1-[3-第3ブチル-5-(4-ヒドロキシペペリジン-1-イル)-4-メトキシ-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル]-エタノン;臭化水素酸塩	0.029	0.084	0.023
実施例 10		{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-エチル)-アセチル]-2-メトキシ-フルアミノ}-アセトニトリル;臭化水素酸塩	0.026	0.024	0.034

表 2

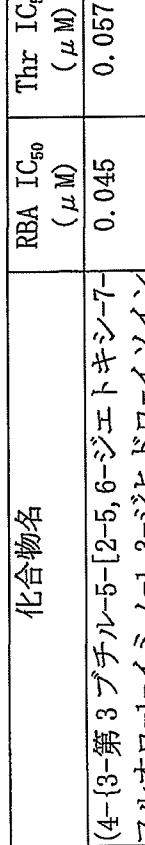
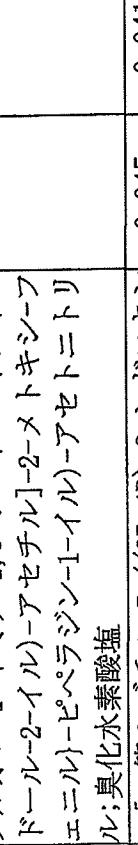
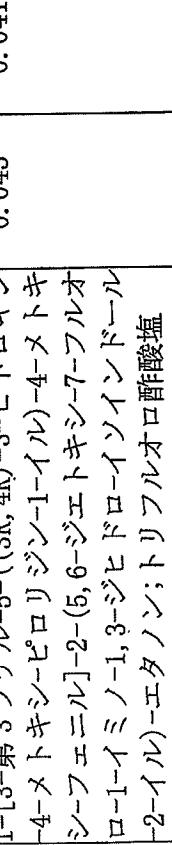
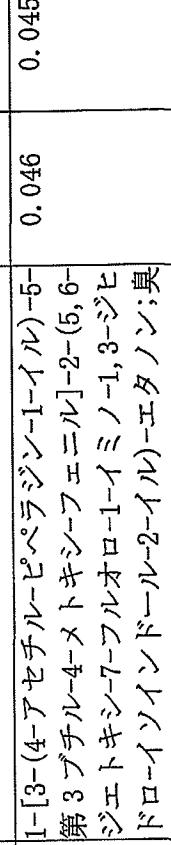
実施例 No.	化合物	化合物名	RBA IC ₅₀ (μ M)	Thr IC ₅₀ (μ M)	Rat SMC IC ₅₀ (μ M)
実施例 11		(4-{3-[3-(4-fluoro-2-methoxyphenyl)propyl]amino}-1,3-dihydroisobenzofuran-5-yl)-2-methylpropanoic acid methyl ester; 臭化水素酸塩	0.045	0.057	0.075
実施例 12		1-[3-[3-(4-fluoro-2-methoxyphenyl)propyl]amino]-5,6-dihydro-2H-pyran-2-one; 臭化水素酸塩	0.045	0.041	0.021
実施例 13		1-[3-(4-((4-fluorophenoxy)methyl)amino)-5,6-dihydro-2H-pyran-2-one; 臭化水素酸塩	0.046	0.045	0.12
実施例 16		1-[3-(4-((4-fluorophenoxy)methyl)amino)-5,6-dihydro-2H-pyran-2-one]propan-1-ol; 臭化水素酸塩	0.053	0.057	0.059

表 3
実施例 No. 化合物名

実施例 No.	化合物名	RBA IC ₅₀ (μ M)	Thr IC ₅₀ (μ M)	Rat SMC IC ₅₀ (μ M)
実施例 17	1-[3-第3ブチル-5-((3S,4S)-3-エトキシ-4-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソイソンドーバー-2-イル)-エタノン; トリフルオロ酢酸塩	0.032	0.08	—
実施例 26	1-(3-第3ブチル-5-イソプロピラミノ)-4-メトキシ-フェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソイソンドーバー-2-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩	0.017	0.079	0.062
実施例 28	1-(3-第3ブチル-5-エトキシ-4-メトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソイソンドーバー-2-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩	0.026	0.044	0.05
実施例 29	エチルカルバミン酸-2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-2-イル)-アセチル]-6-エトキシ-フェニルエステル; 臭化水素酸塩	0.076	0.052	0.07

表 4

実施例 No.	化合物	化合物名	RBA IC ₅₀ (μM)	Thr IC ₅₀ (μM)	Rat SMC IC ₅₀ (μM)
実施例 94		1-[3-{3-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-1H-インドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フエニル}-1-ピペリジン-4-オン；臭化水素酸塩	0.013	0.029	0.044
実施例 109		2-[2-(3-{3-[2-(5-エトキシ-4-ヒドロ-1H-indole-2-carbonyl)-1-メチル-3-ヒドロ-1H-indole-2-carbonyl]methyl}-5-カルボン酸メチルアミド)-5-カルボン酸]エチル-2-オキソエチル]-(6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-indole-1H-イソイミド；臭化水素酸塩	0.03	0.012	0.042
実施例 112		1-[3-{3-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-1H-indole-2-イル)-アセタノン；2-塩酸塩]エチル-4-メトキシ-5-ピペラジン-1-イル-ブエニル}-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-1H-indole-2-イル)-アセタノン；2-塩酸塩]	0.03	0.028	0.052
実施例 127		(4-{3-[3-{3-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-1H-indole-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フエニル}-1-ピペラジン-1-イル)-酢酸；2-塩酸塩]	0.017	0.021	0.15

本発明の化合物およびその塩は、試験例 1において優れたトロンビン受容体結合能を示し、特にトロンビンの P A R 1 受容体に対して選択的な結合能を示した。また、本発明の化合物およびその塩は、試験例 2において優れた血小板凝集抑制作用を示した。さらに、本発明の化合物およびその塩は、試験例 3において優れた平滑筋細胞の増殖抑制作用を示した。

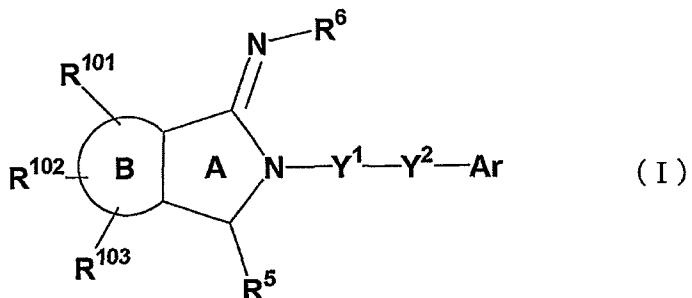
産業上の利用可能性

本発明により、前記式 (I) で表わされる新規な 2-イミノピロリジン誘導体およびその塩を提供することができる。そして、前記式 (I) で表わされる本発明の化合物およびその塩は、優れたトロンビン受容体拮抗作用を有し、特にトロンビンの P A R 1 受容体に対して選択的に拮抗作用を示すものである。従って、本発明の化合物またはその塩によれば、トロンビンのフィブリノーゲンをフィブリンに変換する触媒活性を阻害することなくトロンビンによる血小板凝集などの細胞応答を抑制することができ、また、冠動脈血管形成術等により血管壁に損傷が生じたときに起こる血管平滑筋増殖に対しても P A R 1 選択的阻害に基づいて抑制することが可能となる。

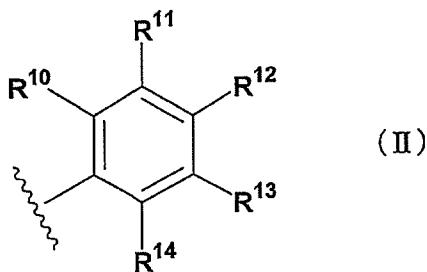
よって、本発明の化合物またはその塩は、トロンビン受容体の拮抗剤（特にトロンビンの P A R 1 受容体の拮抗剤）、血小板凝集阻害剤（抗血栓薬）、平滑筋細胞の増殖阻害剤として有用であり、また、血管形成術中または術後の再狭窄、不安定狭心症、安定狭心症、心筋梗塞、脳梗塞、末梢動脈閉塞等の治療薬または予防薬として有用であり、更に、深部静脈血栓症、肺塞栓症、心房細動に伴う脳塞栓症等の静脈性血栓症、糸球体腎炎症候群等の治療薬または予防薬や、抗炎症剤、抗再狭窄剤としても有用である。

請求の範囲

1. 式



[式中、B環はそれぞれさらに置換基を有していてもよい(1)芳香族炭化水素環または(2)1あるいは2個のNを含有しても良い芳香族複素環を；R¹⁰¹、R¹⁰²およびR¹⁰³は同一または相異なって(1)水素原子または(2)下記置換基群cから選ばれるいずれか1の基を；R⁵は(1)水素原子、(2)シアノ基、(3)ハロゲン原子または(4)下記置換基群aから選ばれるいずれか1の基を；R⁶は(1)水素原子、(2)C₁₋₆アルキル基、(3)アシル基、(4)カルバモイル基、(5)水酸基、(6)C₁₋₆アルコキシ基、(7)C₁₋₆アルキルオキシカルボニルオキシ基、(8)C₃₋₈環状アルキル基、(9)アシルオキシ基で置換されていてもよいC₁₋₆アルキルオキシカルボニル基または(10)それぞれ下記置換基群eから選ばれる少なくとも1の基で置換されていてもよいC₆₋₁₄芳香族炭化水素環式基もしくは5乃至14員芳香族複素環式基を；Y¹は単結合、-(CH₂)_m-、-CR⁸-、-CR⁸R⁹-、-CH₂CO-、-NR⁸-、-SO-、-SO₂-、-CO-、-CONR⁸-または-SO₂NR⁸-〔式中、mは1乃至3の整数を、R⁸およびR⁹は同一または相異なる水素原子、ハロゲン原子、C₁₋₆アルキル基、カルボキシル基またはC₁₋₆アルコキシカルボニル基を示す〕を；Y²は単結合、O、N、-(CH₂)_m-、-CR⁸-、CR⁸R⁹-、-CO-、-SO-、-SO₂-または-C(=N-O-R⁸)-〔式中、m、R⁸およびR⁹は前記定義と同意義を示す〕を；Arは(1)水素原子、(2)式



[式中、R¹⁰、R¹¹、R¹²、R¹³およびR¹⁴は同一または相異なって(1)水素原子、(2)シアノ基、(3)ハロゲン原子、(4)ニトロ基または(5)下記置換基群 b から選ばれるいずれか1の基を示し、さらに、R¹¹とR¹²、または、R¹²とR¹³は結合してN、SおよびOから選ばれる1乃至4個の複素原子を含有していてもよくかつ下記置換基群 f から選ばれる少なくとも1の基で置換されていてもよい5乃至8員複素環を形成していてもよい。]で表わされる基または(3)下記置換基群 g から選ばれる少なくとも1の基で置換されていてもよい5乃至14員芳香族複素環式基を示す。

10 <前記置換基群 a >下記置換基群 a' から選ばれる少なくとも1の基でそれぞれ置換されていてもよいC₁₋₆アルキル基、アルキリデン基、C₂₋₆アルケニル基、C₂₋₆アルキニル基、アシル基、カルボキシル基、カルバモイル基、C₁₋₆アルコキシカルボニル基、C₁₋₆アルキルアミノカルボニル基、水酸基、C₁₋₆アルコキシ基、C₃₋₈環状アルキルオキシ基、アミノ基、C₁₋₆アルキルアミノ基、C₃₋₈環状アルキルアミノ基、アシルアミノ基、スルホニルアミノ基、スルホニル基、スルファモイル基、C₃₋₈環状アルキル基、5乃至14員非芳香族複素環式基、C₆₋₁₄芳香族炭化水素環式基および5乃至14員芳香族複素環式基からなる群；

20 <前記置換基群 a' >C₁₋₆アルキル基、C₂₋₆アルケニル基、C₂₋₆アルキニル基、シアノ基、アシル基、カルボキシル基、カルバモイル基、C₁₋₆アルコキシカルボニル基、C₁₋₆アルキルアミノカルボニル基、水酸基、C₁₋₆アルコキシ基、C₃₋₈環状アルキルオキシ基、アミノ基、C₁₋₆アルキルアミノ基、C₃₋₈

環状アルキルアミノ基、アシルアミノ基、ウレイド基、ウレニレン基、スルホニルアミノ基、スルホニル基、スルファモイル基、ハロゲン原子、C₃₋₈環状アルキル基、含ヘテロ環状アルキル基、5乃至14員非芳香族複素環式基、C₆₋₁₄芳香族炭化水素環式基および5乃至14員芳香族複素環式基からなる群を示し、

5 更に、前記C₆₋₁₄芳香族炭化水素環式基および5乃至14員芳香族複素環式基は、それぞれC₁₋₆アルキル基、シアノ基、アシル基、カルボキシル基、カルバモイル基、C₁₋₆アルコキシカルボニル基、C₁₋₆アルキルアミノカルボニル基、水酸基、C₁₋₆アルコキシ基、C₃₋₈環状アルキルオキシ基、ニトロ基、アミノ基、C₁₋₆アルキルアミノ基、C₃₋₈環状アルキルアミノ基、アシルアミノ基、ウレイド基、ウレニレン基、スルホニルアミノ基、スルホニル基、スルファモイル基、ハロゲン原子およびC₃₋₈環状アルキル基からなる群より選ばれる少なくとも1の基で置換されていてもよい；

<前記置換基群b>下記置換基群b'から選ばれる少なくとも1の基でそれぞれ置換されていてもよいC₁₋₆アルキル基、C₂₋₆アルケニル基、C₂₋₆アルキニル基、アシル基、カルボキシル基、カルバモイル基、C₁₋₆アルコキシカルボニル基、C₁₋₆アルキルアミノカルボニル基、水酸基、C₁₋₆アルコキシ基、C₃₋₈環状アルキルオキシ基、アミノ基、C₁₋₆アミノアルキル基、C₁₋₆アルキルアミノ基、C₃₋₈環状アルキルアミノ基、アシルアミノ基、ウレイド基、スルホニルアミノ基、スルホニル基、スルファモイル基、C₃₋₈環状アルキル基、5乃至14員非芳香族複素環式基、C₆₋₁₄芳香族炭化水素環式基および5乃至14員芳香族複素環式基からなる群；

<前記置換基群b'>C₁₋₆アルキル基、C₂₋₆アルケニル基、C₂₋₆アルキニル基、オキソ基、シアノ基、C₁₋₆シアノアシル基、C₂₋₇アシル基、C₁₋₆アルカノイル基、ベンゾイル基、アラルカノイル基、C₁₋₆アルコキシアルキルカルボニル基、C₁₋₆ヒドロキシアルキルカルボニル基、カルボキシル基、C₁₋₆カルボキシルアルキル基、C₁₋₆カルボキシルアルキルオキシ基、カルバモイル基、

カルバモイルアルキルオキシ基、 C_{1-6} アルコキシカルボニル基、 C_{1-10} アルコキシカルボニル C_{1-6} アルキル基、 C_{1-10} アルコキシカルボニル C_{1-6} アルキルオキシ基、 C_{1-6} モノアルキルアミノカルボニル基、 C_{2-6} ジアルキルアミノカルボニル基、水酸基、 C_{1-6} アルコキシ基、 C_{1-10} アルコキシアルキル基、 C_{1-10} アラルキルオキシアルキル基、 C_{1-6} ヒドロキシアルキル基、 C_{3-8} 環状アルキルオキシ基、アミノ基、 C_{1-6} アルキルアミノ基、 C_{3-8} 環状アルキルアミノ基、アシルアミノ基、ウレイド基、ウレイレン基、 C_{1-6} アルキルスルホニルアミノ基、フェニルスルホニルアミノ基、 C_{1-6} アルキルスルホニル基、フェニルスルホニル基、 C_{1-6} モノアルキルアミノスルホニル基、 C_{2-6} ジアルキルアミノスルホニル基、スルファモイル基、ハロゲノ基、 C_{3-8} 環状アルキル基、5乃至14員非芳香族複素環式基、 C_{6-14} 芳香族炭化水素環式基、5乃至14員芳香族複素環式基、含ヘテロ環状アミノカルボニル基、含ヘテロ環状アミノスルホニル基およびイソキサゾリニル基からなる群を示し、更に、前記5乃至14員非芳香族複素環式基、 C_{6-14} 芳香族炭化水素環式基、5乃至14員芳香族複素環式基およびイソキサゾリニル基は、独立に、 C_{1-6} アルキル基、オキソ基、シアノ基、アシル基、カルボキシル基、カルバモイル基、 C_{1-6} アルコキシカルボニル基、 C_{1-6} アルキルアミノカルボニル基、水酸基、 C_{1-6} アルコキシ基、 C_{3-8} 環状アルキルオキシ基、ニトロ基、アミノ基、 C_{1-6} アミノアルキル基、 C_{1-6} アルキルアミノ基、 C_{1-6} ジアルキルアミノ基、 C_{3-8} 環状アルキルアミノ基、アシルアミノ基、ウレイド基、ウレイレン基、アルキルスルホニルアミノ基、アルキルスルホニル基、スルファモイル基、ハロゲノ基および C_{3-8} 環状アルキル基からなる群より選ばれる少なくとも1の基で置換されていてもよい；
 <前記置換基群c>(1)シアノ基、(2)ハロゲン原子ならびに(3)下記置換基群c'から選ばれる少なくとも1の基でそれぞれ置換されていてもよい C_{1-6} アルキル基、 C_{2-8} アルケニル基、 C_{2-8} アルキニル基、アシル基、カルボキシル基、カルバモイル基、 C_{1-6} アルコキシカルボニル基、 C_{1-6} アルキルアミノカルボニ

ル基、水酸基、C₁₋₆アルコキシ基、C₃₋₈環状アルキルオキシ基、アミノ基、C₁₋₆アルキルアミノ基、C₃₋₈環状アルキルアミノ基、アシルアミノ基、ウレイド基、スルホニルアミノ基、スルホニル基、スルファモイル基、C₃₋₈環状アルキル基、5乃至14員非芳香族複素環式基、C₆₋₁₄芳香族炭化水素環式基および5乃至14員芳香族複素環式基からなる群；

<前記置換基群c'>C₁₋₆アルキル基、C₂₋₈アルケニル基、C₂₋₈アルキニル基、シアノ基、アシル基、カルボキシル基、カルバモイル基、C₁₋₆アルコキシカルボニル基、C₁₋₆アルキルアミノカルボニル基、水酸基、C₁₋₆アルコキシ基、C₃₋₈環状アルキルオキシ基、アミノ基、C₁₋₆アルキルアミノ基、C₃₋₈環状アルキルアミノ基、アシルアミノ基、ウレイド基、ウレニレン基、スルホニルアミノ基、スルホニル基、スルファモイル基、ハロゲノ基、C₃₋₈環状アルキル基、5乃至14員非芳香族複素環式基、C₆₋₁₄芳香族炭化水素環式基および5乃至14員芳香族複素環式基からなる群；

<前記置換基群e>C₁₋₆アルキル基、シアノ基、アシル基、カルボキシル基、カルバモイル基、C₁₋₆アルコキシカルボニル基、C₁₋₆アルキルアミノカルボニル基、水酸基、C₁₋₆アルコキシ基、C₃₋₈環状アルキルオキシ基、アミノ基、C₁₋₆アルキルアミノ基、C₃₋₈環状アルキルアミノ基、アシルアミノ基、ウレイド基、ウレニレン基、スルホニルアミノ基、スルホニル基、スルファモイル基、ハロゲン原子およびC₃₋₈環状アルキル基からなる群；

<前記置換基群f>(1)水素原子、(2)シアノ基、(3)ハロゲン原子、(4)オキソ基ならびに(5)それぞれ下記置換基群f'から選ばれる少なくとも1の基で置換されていてよいC₁₋₆アルキル基、アルケニル基、アルキニル基、アシル基、C₁₋₆アルカノイル基、カルボキシル基、カルバモイル基、C₁₋₆アルコキシカルボニル基、C₁₋₆アルキルアミノカルボニル基、水酸基、C₁₋₆アルコキシ基、C₃₋₈環状アルキルオキシ基、アミノ基、イミノ基、C₁₋₆アミノアルキル基、C₁₋₆アルキルアミノ基、C₃₋₈環状アルキルアミノ基、アシルアミノ基、ウレイド基、

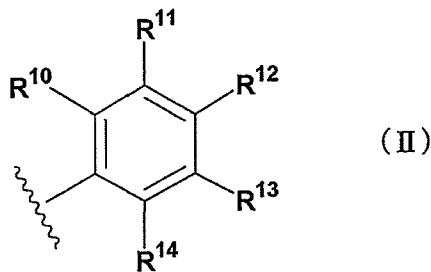
スルホニルアミノ基、スルホニル基、スルファモイル基、C₃₋₈環状アルキル基、5乃至14員非芳香族複素環式基、C₆₋₁₄芳香族炭化水素環式基および5乃至14員芳香族複素環式基からなる群；

5 <前記置換基群f'> C₁₋₆アルキル基、オキソ基、シアノ基、アシル基、カルボキシル基、カルバモイル基、C₁₋₆アルコキシカルボニル基、ベンジルオキシカルボニル基、C₁₋₆アルキルアミノカルボニル基、水酸基、C₁₋₆アルコキシ基、C₃₋₈環状アルキルオキシ基、アミノ基、C₁₋₆アルキルアミノ基、C₃₋₈環状アルキルアミノ基、アシルアミノ基、ウレイド基、ウレニレン基、C₁₋₆アルキルスルホニルアミノ基、C₁₋₆アルキルスルホニル基、スルファモイル基、10 ハロゲノ基、C₃₋₈環状アルキル基、5乃至14員非芳香族複素環式基、C₆₋₁₄芳香族炭化水素環式基および5乃至14員芳香族複素環式基からなる群；

<前記置換基群g> C₁₋₆アルキル基、シアノ基、アシル基、カルボキシル基、カルバモイル基、C₁₋₆アルコキシカルボニル基、C₁₋₆アルキルアミノカルボニル基、スルホニル基、スルファモイル基、ハロゲノ基およびC₃₋₈環状アルキル基からなる群。]

で表わされる化合物またはその塩。

2. B環はそれぞれさらに置換基を有していてもよいベンゼン環またはピリジン環を；R¹⁰¹、R¹⁰²およびR¹⁰³は同一または相異なって水素原子、ハロゲン原子、C₁₋₆アルキル基、C₁₋₆アルキルアミノカルボニル基、C₁₋₆アルコキシ基、C₁₋₆アルキルアミノ基およびC₃₋₈環状アルキル基からなる群から選ばれるいずれか1の基を；R⁵は水素原子、C₁₋₆アルキル基およびC₁₋₆アルコキシC₁₋₆アルキル基からなる群から選ばれるいずれか1の基を；R⁶は水素原子、C₁₋₆アルキル基およびアシルオキシ基で置換されていてもよいC₁₋₆アルキルオキシカルボニル基からなる群から選ばれるいずれか1の基を；Y¹は単結合または- (CH₂)_m - [式中、mは1乃至3の整数を示す]を；Y²は単結合または-CO-を；Arは水素原子または式



[式中、R¹⁰、R¹¹、R¹²、R¹³およびR¹⁴は同一または相異なって水素原子、C₁₋₆アルキル基、水酸基、C₁₋₆アルコキシ基、C₁₋₆アルキルアミノ基、C₃₋₈環状アルキルアミノ基、アシルアミノ基、5乃至14員非芳香族複素環式基およびC₁₋₆アルキルオキシカルボニルオキシ基からなる群から選ばれるいずれか1の基を示し、さらに、R¹¹とR¹²、または、R¹²とR¹³は結合して、(i)N、SおよびOから選ばれる1乃至4個の複素原子を含有していてもよく、かつ(ii)シアノ基、オキソ基ならびにそれぞれ下記置換基群f”：

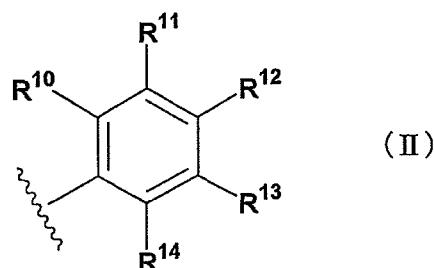
<前記置換基群f”>C₁₋₆アルキル基、オキソ基、シアノ基、アシル基、カルボキシル基およびC₁₋₆アルコキシ基からなる群；
から選ばれる少なくとも1の基で置換されていてもよいC₁₋₆アルキル基、アシル基、C₁₋₆アルカノイル基、カルボキシル基、カルバモイル基、C₁₋₆アルコキシカルボニル基、C₁₋₆アルキルアミノカルボニル基、水酸基、C₁₋₆アルコキシ基、C₃₋₈環状アルキルオキシ基、アミノ基、C₁₋₆アルキルアミノ基、スルホニル基および5乃至14員非芳香族複素環式基からなる群から選ばれる少なくとも1の基で置換されていてもよい、5乃至8員複素環を形成していてよい。]で表わされる基を示す、請求項1記載の化合物またはその塩。

3. B環が置換基を有していてもよいベンゼン環である請求項1記載の化合物またはその塩。
4. Y¹が—CH₂—である請求項1記載の化合物またはその塩。
5. Y²が—CO—である請求項1記載の化合物またはその塩。
6. Y¹が—CH₂—で、Y²が—CO—である請求項1記載の化合物または

その塩。

7. Y^1 が単結合で、 Y^2 が単結合で、 A_r が水素原子である請求項1記載の化合物またはその塩。

8. A_r が式

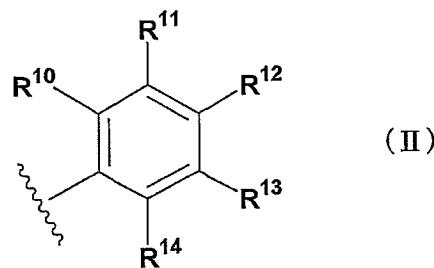


5

[式中、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} および R^{14} は前記定義と同意義を示す。] で表わされる基である請求項1記載の化合物またはその塩。

9. R^{10} および R^{14} が水素原子である請求項8記載の化合物またはその塩。

10. A_r が(1)式



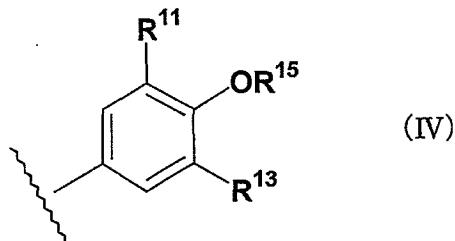
10

[式中、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} および R^{14} はそれぞれ前記定義と同意義を示す。] で表わされる基または(2)前記置換基群gから選ばれる少なくとも1の基で置換されていてもよい5乃至14員芳香族複素環式基である請求項1記載の化合物またはその塩。

15

11. R^{10} および R^{14} が水素原子である請求項10記載の化合物またはその塩。

12. A_r が式

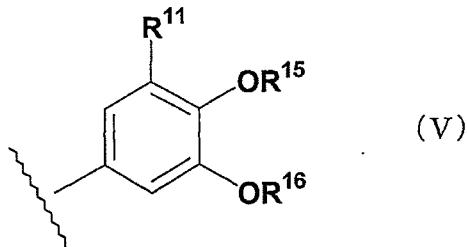


[式中、R¹¹およびR¹³は前記定義と同意義を、R¹⁵は(1)水素原子または(2)下記置換基群hから選ばれるいずれか1の基を示し、さらに、R¹¹およびR¹⁵は結合して前記置換基群fから選ばれる少なくとも1の基で置換されていてもよくN、SおよびOから選ばれる1または2個の複素原子を含有していてもよい5乃至8員複素環を形成してもよい。

<前記置換基群h>下記置換基群h'から選ばれる少なくとも1の基でそれぞれ置換されていてもよいC₁₋₆アルキル基、C₂₋₆アルケニル基、C₂₋₆アルキニル基、アシル基、C₁₋₆アルコキシカルボニル基、アミノカルボニル基、C₁₋₆アルキルアミノカルボニル基、C₃₋₈環状アルキル基、C₁₋₆アミノアルキル基、スルホニル基、C₃₋₈環状アルキルアミノ基、5乃至14員非芳香族複素環式基、C₆₋₁₄芳香族炭化水素環式基および5乃至14員芳香族複素環式基からなる群；<前記置換基群h'>C₁₋₆アルキル基、C₂₋₆アルケニル基、C₂₋₆アルキニル基、オキソ基、シアノ基、C₁₋₆シアノアルキル基、C₂₋₇アシル基、C₁₋₆アルカノイル基、ベンゾイル基、アラルカノイル基、C₁₋₆アルコキシアルキルカルボニル基、C₁₋₆ヒドロキシアルキルカルボニル基、カルボキシル基、C₁₋₆カルボキシルアルキル基、C₁₋₆カルボキシルアルキルオキシ基、カルバモイル基、カルバモイルアルキルオキシ基、C₁₋₆アルコキシカルボニル基、C₁₋₁₀アルコキシカルボニルC₁₋₆アルキル基、C₁₋₁₀アルコキシカルボニルC₁₋₆アルキルオキシ基、C₁₋₆モノアルキルアミノカルボニル基、C₂₋₆ジアルキルアミノカルボニル基、水酸基、C₁₋₆アルコキシ基、C₁₋₁₀アルコキシアルキル基、C₁₋₁₀アラルキルオキシアルキル基、C₁₋₆ヒドロキシアルキル基、C₃₋₈環状アル

キルオキシ基、アミノ基、C₁₋₆アルキルアミノ基、C₃₋₈環状アルキルアミノ基、アシルアミノ基、ウレイド基、ウレイレン基、C₁₋₆アルキルスルホニルアミノ基、フェニルスルホニルアミノ基、C₁₋₆アルキルスルホニル基、フェニルスルホニル基、C₁₋₆モノアルキルアミノスルホニル基、C₂₋₆ジアルキルアミノスルホニル基、スルファモイル基、ハロゲノ基、C₃₋₈環状アルキル基、5乃至14員非芳香族複素環式基、C₆₋₁₄芳香族炭化水素環式基、5乃至14員芳香族複素環式基、含ヘテロ環状アミノカルボニル基、含ヘテロ環状アミノスルホニル基およびイソキサゾリニル基からなる群を示し、更に、前記5乃至14員非芳香族複素環式基、C₆₋₁₄芳香族炭化水素環式基、5乃至14員芳香族複素環式基およびイソキサゾリニル基は、独立に、C₁₋₆アルキル基、オキソ基、シアノ基、アシル基、カルボキシル基、カルバモイル基、C₁₋₆アルコキシカルボニル基、C₁₋₆アルキルアミノカルボニル基、水酸基、C₁₋₆アルコキシ基、C₃₋₈環状アルキルオキシ基、ニトロ基、アミノ基、C₁₋₆アミノアルキル基、C₁₋₆アルキルアミノ基、C₁₋₆ジアルキルアミノ基、C₃₋₈環状アルキルアミノ基、アシルアミノ基、ウレイド基、ウレイレン基、アルキルスルホニルアミノ基、アルキルスルホニル基、スルファモイル基、ハロゲノ基およびC₃₋₈環状アルキル基からなる群から選ばれる少なくとも1の基で置換されていてもよい。]で表される基である請求項1記載の化合物またはその塩。

13. Arが式

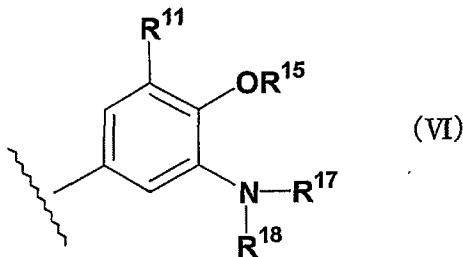


20

[式中、R¹¹およびR¹⁵はそれぞれ前記定義と同意義を、R¹⁶は(1)水素原子または(2)前記置換基群hから選ばれるいずれか1の基を示し、さらに、R¹¹とR¹

⁵、または、R¹⁵とR¹⁶が結合して前記置換基群fから選ばれる少なくとも1の基で置換されていてもよくN、SおよびOから選ばれる1または2個の複素原子を有していてもよい5乃至6員複素環を形成していてもよい。】
で表される基である請求項1記載の化合物またはその塩。

5 14. Arが式



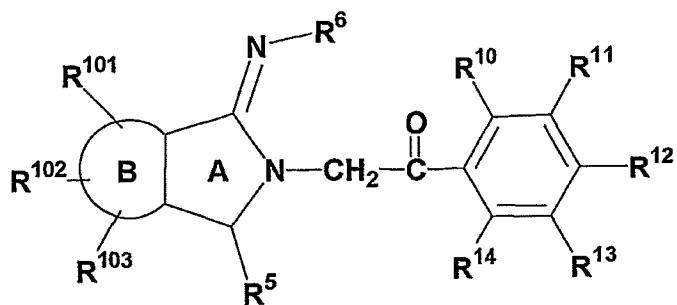
[式中、R¹¹およびR¹⁵はそれぞれ前記定義と同意義を、R¹⁷およびR¹⁸は同一または相異なって(1)水素原子または(2)下記置換基群iから選ばれるいずれか1の基を示し、さらに、R¹¹とR¹⁵、R¹⁵とR¹⁷、R¹⁵とR¹⁸、または、R¹⁷とR¹⁸は結合して前記置換基群fから選ばれる少なくとも1の基で置換されていてもよくN、SおよびOから選ばれる1または2個の複素原子を含有していてもよい5乃至8員複素環を形成してもよい。

<前記置換基群i>下記置換基群i'から選ばれる少なくとも1の基でそれぞれ置換されていてもよいC₁₋₆アルキル基、C₂₋₆アルケニル基、C₂₋₆アルキニル基、アシル基、カルバモイル基、C₁₋₆アルコキシカルボニル基、C₁₋₆アルキルアミノカルボニル基、C₁₋₆アミノアルキル基、スルホニル基、スルファモイル基、C₃₋₈環状アルキル基、5乃至14員非芳香族複素環式基、C₆₋₁₄芳香族炭化水素環式基および5乃至14員芳香族複素環式基からなる群；

<前記置換基群i'>C₁₋₆アルキル基、C₂₋₆アルケニル基、C₂₋₆アルキニル基、オキソ基、シアノ基、C₁₋₆シアノアルキル基、C₂₋₇アシル基、C₁₋₆アルカノイル基、ベンゾイル基、アラルカノイル基、C₁₋₆アルコキシアルキルカルボニル基、C₁₋₆ヒドロキシアルキルカルボニル基、カルボキシル基、C₁₋₆カ

ルボキシルアルキル基、 C_{1-6} カルボキシルアルキルオキシ基、カルバモイル基、カルバモイルアルキルオキシ基、 C_{1-6} アルコキシカルボニル基、 C_{1-10} アルコキシカルボニル基、 C_{1-6} アルキル基、 C_{1-10} アルコキシカルボニル基、 C_{1-6} アルキルオキシ基、 C_{1-6} モノアルキルアミノカルボニル基、 C_{2-6} ジアルキルアミノカルボニル基、水酸基、 C_{1-6} アルコキシ基、 C_{1-10} アルコキシアルキル基、 C_{1-10} アルキルオキシアルキル基、 C_{1-6} ヒドロキシアルキル基、 C_{3-8} 環状アルキルオキシ基、アミノ基、 C_{1-6} アルキルアミノ基、 C_{3-8} 環状アルキルアミノ基、アシルアミノ基、ウレイド基、ウレイレン基、 C_{1-6} アルキルスルホニルアミノ基、フェニルスルホニルアミノ基、 C_{1-6} アルキルスルホニル基、フェニルスルホニル基、 C_{1-6} モノアルキルアミノスルホニル基、 C_{2-6} ジアルキルアミノスルホニル基、スルファモイル基、ハロゲノ基、 C_{3-8} 環状アルキル基、5乃至14員非芳香族複素環式基、 C_{6-14} 芳香族炭化水素環式基、5乃至14員芳香族複素環式基、含ヘテロ環状アミノカルボニル基、含ヘテロ環状アミノスルホニル基およびイソキサゾリニル基からなる群を示し、更に、前記5乃至14員非芳香族複素環式基、 C_{6-14} 芳香族炭化水素環式基、5乃至14員芳香族複素環式基およびイソキサゾリニル基は、独立に、 C_{1-6} アルキル基、オキソ基、シアノ基、アシル基、カルボキシル基、カルバモイル基、 C_{1-6} アルコキシカルボニル基、 C_{1-6} アルキルアミノカルボニル基、水酸基、 C_{1-6} アルコキシ基、 C_{3-8} 環状アルキルオキシ基、ニトロ基、アミノ基、 C_{1-6} アミノアルキル基、 C_{1-6} アルキルアミノ基、 C_{1-6} ジアルキルアミノ基、 C_{3-8} 環状アルキルアミノ基、アシルアミノ基、ウレイド基、ウレイレン基、アルキルスルホニルアミノ基、アルキルスルホニル基、スルファモイル基、ハロゲノ基および C_{3-8} 環状アルキル基からなる群から選ばれる少なくとも1の基で置換されていてもよい。] で表わされる基である請求項1記載の化合物またはその塩。

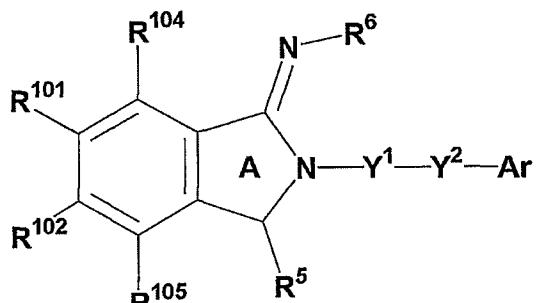
25 15. 化合物が式



[式中の記号の意義は前記定義と同意義を示す。]

で表される請求項 1 記載の化合物またはその塩。

16. 化合物が式

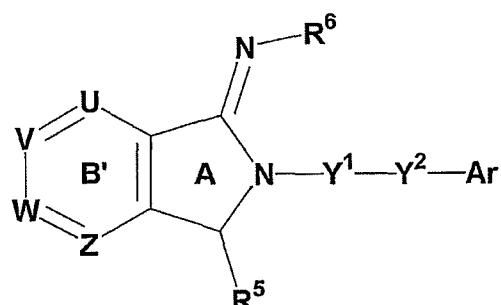


5

[式中、R¹⁰⁴およびR¹⁰⁵は同一または相異なって水素原子、C₁₋₆アルコキシ基、C₁₋₆アルキル基またはハロゲン原子を、R¹⁰¹、R¹⁰²、R⁵、R⁶、Y¹、Y²およびArはそれぞれ前記定義と同意義を示す。]

で表される請求項 1 記載の化合物またはその塩。

10 17. 化合物が式



[式中、UはNまたはCHを示し、VはNまたはCR¹⁰¹を示し、WはNまたは

CR¹⁰²を示し、ZはNまたはCR¹⁰⁵を示し、U、V、W、Zの内1個あるいは2個がNであり；R¹⁰¹、R¹⁰²、R¹⁰⁵、R⁵、R⁶、Y¹、Y²およびArはそれぞれ前記定義と同意義を示す。]

で表される請求項1記載の化合物またはその塩。

5 18. Y¹は-CH₂-である請求項16または17記載の化合物またはその塩。

19. Y²は-CO-である請求項16または17記載の化合物またはその塩。

10 20. UがNで、VがCR¹⁰¹ [R¹⁰¹は前記定義と同意義を示す] である請求項17記載の化合物またはその塩。

21. 請求項1記載の化合物またはその塩を含有してなる医薬組成物。

22. トロンビン受容体拮抗剤である請求項21記載の組成物。

23. トロンビンのPAR1受容体拮抗剤である請求項21記載の組成物。

24. 血小板凝集阻害剤である請求項21記載の組成物。

15 25. 平滑筋細胞の増殖阻害剤である請求項21記載の組成物。

26. 内皮細胞、纖維芽細胞、腎細胞、骨肉腫細胞、筋細胞、ガン細胞および／またはグリア細胞の増殖阻害剤である請求項21記載の組成物。

20 27. 血栓症、血管再狭窄、深部静脈血栓症、肺塞栓症、脳梗塞、心疾患、播種性血管内血液凝固症候群、高血圧、炎症性疾患、リウマチ、喘息、糸球体腎炎、骨粗鬆症、神経疾患および／または悪性腫瘍の治療剤または予防剤である請求項21記載の組成物。

28. トロンビン受容体拮抗剤の製造のための請求項1記載の化合物またはその塩の使用。

25 29. トロンビン受容体拮抗剤がPAR1受容体拮抗剤である請求項28記載の使用。

30. 血小板凝集阻害剤の製造のための請求項1記載の化合物またはその塩

の使用。

31. トロンビン受容体が関与する疾患の患者に、治療上有効量の請求項1記載の化合物またはその塩を投与する、前記疾患の治療方法。

32. 内皮細胞、纖維芽細胞、腎細胞、骨肉腫細胞、筋細胞、ガン細胞および／またはグリア細胞の増殖性疾患を有する患者に、治療上有効量の請求項1記載の化合物またはその塩を投与する、前記疾患の治療方法。
5

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP02/03961

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl⁷ C07D209/44, 209/62, 401/10, 403/06, 403/10, 405/06,
 413/06, 471/04, A61K31/403, 4035, 4178, 4184, 422, 437,
 A61K31/454,
 496, 538, 5377, A61P7/02, 9/00, 9/10, 9/12, 11/00, 11/06, 13/12,

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl⁷ C07D209/44, 209/62, 401/10, 403/06, 403/10, 405/06,
 413/06, 471/04, A61K31/403, 4035, 4178, 4184, 422, 437,
 A61K31/454,
 496, 538, 5377, A61P7/02, 9/00, 9/10, 9/12, 11/00, 11/06, 13/12,

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

CAPLUS (STN), REGISTRY (STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 00/67755 A1 (Merck & Co., Inc.), 16 November, 2000 (16.11.00), & US 6376530 B & EP 1178802 A1	1-4, 8-11, 16, 18, 21
X	EP 847749 A1 (L'oreal), 17 June, 1998 (17.06.98), & FR 2757053 A & CA 2222363 A & JP 10-175831 A & US 6077320 A	1-4, 16, 18
X	JP 3-50555 A (NEC Corp.), 05 March, 1991 (05.03.91), (Family: none)	1-3, 16
X	JP 62-22760 A (Sankyo Co., Ltd.), 30 January, 1987 (30.01.87), (Family: none)	1-3, 8, 10, 16

 Further documents are listed in the continuation of Box C. See patent family annex.

* Special categories of cited documents: "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance "E" earlier document but published on or after the international filing date "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed	"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art "&" document member of the same patent family
---	--

Date of the actual completion of the international search 14 June, 2002 (14.06.02)	Date of mailing of the international search report 02 July, 2002 (02.07.02)
Name and mailing address of the ISA/ Japanese Patent Office	Authorized officer
Faxsimile No.	Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP02/03961

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	JP 53-71063 A (Grelan Pharm. Co., Ltd.), 24 June, 1978 (24.06.78), (Family: none)	1-3,8-11,16
X	DE 2551868 A (Gruppo Lepetit S.P.A.), 12 August, 1976 (12.08.76), & IN 141710 A & ZA 7506792 A & AU 7586204 A & FI 7503045 A & FI 7503046 A & IL 48389 A & NL 7512848 A & NO 7503853 A & NO 7503854 A & DK 7505221 A & DK 7505222 A & BE 835836 A & AT 7508845 A & SE 7513137 A & SE 7513138 A & FR 2291747 A & JP 51-75098 A & ES 442863 A & CH 614208 A & CA 1068273 A & CA 1068274 A	1-11,15,16, 18,19
X	DE 2154525 A (Erba Carlo S.P.A.), 15 June, 1972 (15.06.72), & GB 1344663 A & IL 38023 A & AU 7135081 A & ES 396473 A & ZA 7107259 A & CA 978973 A & BE 774985 A & NL 7115288 A & FR 2112480 A & CH 558353 A & CH 559174 A & CH 559175 A & CH 559176 A & JP 51-68563 A & JP 52-17463 A & JP 52-31066 A & JP 52-31065 A & US 4118504 A & JP 54-117464 A	1-3,8-11,16
X	Chemical Abstracts, Vol.127, abs.No.81319	1-3,8-11,16
X	Z.Naturforsch., B:Chemical Sci., (1996), 51(12), p.1791-810	1-3,7-12,16
X	Bulletin Soc.Chim.Belg., (1992), 101(6), p.509-12	1-3,8-11,16
X	Khim.Geterotsikl.Soedin., (1987), (9), p.1264-9	1-3,8-11,16
X	Vest.Kiev.Un-ta.Khimiya, (1985), (26), p.21-5	1-3,8-12,16
X	Ukr.Khim.Zh., (1985), 51(6), p.644-9	1-6,8-12, 15,16,18,19
X	Arch Pharm., (1985), 318(8), p.735-43	1-3,8-11,16
X	Chemical Abstracts, Vol.103, abs.No.104932	1-4,7-11, 16,18
X	Ukr.Khim.Zh., (1984), 50(11), p.1198-203	1-4,8-12, 16,18
X	Chemical Abstracts, Vol.102, abs.No.220805	1-3,16

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP02/03961

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	Ukr.Khim.Zh., (1984), 50(10), p.1105-10	1-6, 8-13, 15, 16, 18, 19
X	Ukr.Khim.Zh., (1984), 50(5), p.530-4	1-4, 8-12, 16, 18
X	Ukr.Khim.Zh., (1981), 47(7), p.735-8	1-3, 5, 8-13, 16, 19
X	Ukr.Khim.Zh., (1981), 47(3), p.291-5	1-3, 5, 8-11, 16, 19
X	J.Heterocycl.Chem., (1978), 15(3), p.369-75	1-3, 8-11, 16
X	Arch.Pharm., (1976), 309(5), p.356-66	1-3, 8-11, 16
X	Z.Naturforsch., Teil B, (1973), 28(11-12), p.801-4	1-3, 7, 16
X	Arzneim.-Forsch., (1973), 23(8), p.1090-100	1-3, 8-11, 16
X	Chemical Abstracts, Vol.76, abs.No.153482	1-3, 8-11, 16
X	Chemical Abstracts, Vol.72, abs.No.132428	1-3, 8-12, 16
X	Chemical Abstracts, Vol.53, abs.No.16106c-16107d	1-3, 8-11, 16
X	Chemical Abstracts, Vol.53, abs.No.15082h-15085d	1-3, 8-11, 16
A	WO 98/37075 A1 (Boehringer Ingelheim Pharma KG), 27 August, 1998 (27.08.98), & AU 9863991 A & DE 19751939 A & DE 19706229 A & ZA 9801275 A & NO 9903945 A & EP 966454 A1 & CN 1248251 A & SK 9901121 A & CZ 9902915 A & US 6087380 A & NZ 337323 A & BR 9807843 A & KR 2000071066 A & HU 200001116 A & JP 2001-509815 A	1-30
A	WO 99/40072 A1 (Boehringer Ingelheim Pharma KG), 12 Augsut, 1999 (12.08.99), & AU 9927201 A & DE 19804085 A & DE 19834325 A & US 6114532 A & EP 1060166 A1 & JP 2002-502844 A	1-30

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP02/03961

Box I Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 1 of first sheet)

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1. Claims Nos.: 31, 32

because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:

Claims 31 and 32 pertain to methods for treatment of the human body by therapy.

2. Claims Nos.:

because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:

3. Claims Nos.:

because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

Box II Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 2 of first sheet)

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

1. As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.
2. As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.
3. As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
4. No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

Remark on Protest The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.

No protest accompanied the payment of additional search fees.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP02/03961

Continuation of A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
(International Patent Classification (IPC))

Int.Cl⁷ 19/10, 25/00, 29/00, 35/00, 43/00

(According to International Patent Classification (IPC) or to both
national classification and IPC)

Continuation of B. FIELDS SEARCHED

Minimum Documentation Searched (International Patent Classification
(IPC))

Int.Cl⁷ 19/10, 25/00, 29/00, 35/00, 43/00

Minimum documentation searched (classification system followed by
classification symbols)

国際調査報告

国際出願番号 PCT/JPO2/03961

A. 発明の属する分野の分類（国際特許分類（IPC））

Int. Cl' C07D209/44, 209/62, 401/10, 403/06, 403/10, 405/06, 413/06, 471/04, A61K31/403, 4035, 4178, 4184, 422, 437, A61K31/454, 496, 538, 5377, A61P7/02, 9/00, 9/10, 9/12, 11/00, 11/06, 13/12, 19/10, 25/00, 29/00, 35/00, 43/00

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料（国際特許分類（IPC））

Int. Cl' C07D209/44, 209/62, 401/10, 403/06, 403/10, 405/06, 413/06, 471/04, A61K31/403, 4035, 4178, 4184, 422, 437, A61K31/454, 496, 538, 5377, A61P7/02, 9/00, 9/10, 9/12, 11/00, 11/06, 13/12, 19/10, 25/00, 29/00, 35/00, 43/00

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース（データベースの名称、調査に使用した用語）
CAPLUS, REGISTRY(STN)

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X	WO 00/67755 A1 (MERCK & CO., INC.) 2000.11.16 & US 6376530 B & EP 1178802 A1	1-4, 8-11, 16, 18, 21
X	EP 847749 A1 (L'OREAL) 1998.06.17 & FR 2757053 A & CA 2222363 A & JP 10-175831 A & US 6077320 A	1-4, 16, 18
X	JP 3-50555 A (NEC CORP.) 1991.03.05 (ファミリーなし)	1-3, 16
X	JP 62-22760 A (SANKYO CO., LTD.) 1987.01.30 (ファミリーなし)	1-3, 8, 10, 16

 C欄の続きにも文献が列挙されている。 パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

- 「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの
- 「E」国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの
- 「F」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献（理由を付す）
- 「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献
- 「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

- 「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの
- 「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの
- 「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの
- 「&」同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

14.06.02

国際調査報告の発送日

02.07.02

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/JP)

郵便番号 100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官（権限のある職員）

富永 保



4 P 9159

電話番号 03-3581-1101 内線 3490

国際調査報告

国際出願番号 PCT/JP02/03961

C(続き)	関連すると認められる文献	関連する請求の範囲の番号
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	
X	JP 53-71063 A(GRELAN PHARM. CO., LTD.) 1978. 06. 24 (ファミリーなし)	1-3, 8-11, 16
X	DE 2551868 A(GRUPPO LEPETIT S. P. A.) 1976. 08. 12 & IN 141710 A & ZA 7506792 A & AU 7586204 A & FI 7503045 A & FI 7503046 A & IL 48389 A & NL 7512848 A & NO 7503853 A & NO 7503854 A & DK 7505221 A & DK 7505222 A & BE 835836 A & AT 7508845 A & SE 7513137 A & SE 7513138 A & FR 2291747 A & JP 51-75098 A & ES 442863 A & CH 614208 A & CA 1068273 A & CA 1068274 A	1-11, 15, 16, 1 8, 19
X	DE 2154525 A(ERBA CARLO S.P.A.) 1972. 06. 15 & GB 1344663 A & IL 38023 A & AU 7135081 A & ES 396473 A & ZA 7107259 A & CA 978973 A & BE 774985 A & NL 7115288 A & FR 2112480 A & CH 558353 A & CH 559174 A & CH 559175 A & CH 559176 A & JP 51-68563 A & JP 52-17463 A & JP 52-31066 A & JP 52-31065 A & US 4118504 A & JP 54-117464 A	1-3, 8-11, 16
X	Chemical Abstracts, vol. 127, abs. no. 81319	1-3, 8-11, 16
X	Z. Naturforsch. , B:Chemical Sci. , (1996), 51(12), p. 1791-810	1-3, 7-12, 16
X	Bulletin Soc. Chim. Belg. , (1992), 101(6), p. 509-12	1-3, 8-11, 16
X	Khim. Geterotsikl. Soedin. , (1987), (9) , p. 1264-9	1-3, 8-11, 16
X	Vest. Kiev. Un-ta. Khimiya, (1985), (26), p. 21-5	1-3, 8-12, 16
X	Ukr. Khim. Zh. , (1985), 51(6), p. 644-9	1-6, 8-12, 15, 16, 18, 19,
X	Arch Pharm. , (1985) , 318(8) , p. 735-43	1-3, 8-11, 16
X	Chemical Abstracts, vol. 103, abs. no. 104932	1-4, 7-11, 16, 18
X	Ukr. Khim. Zh. , (1984), 50(11), p. 1198-203	1-4, 8-12, 16, 18
X	Chemical Abstracts, vol. 102, abs. no. 220805	1-3, 16
X	Ukr. Khim. Zh. , (1984), 50(10), p. 1105-10	1-6, 8-13, 15, 16, 18, 19.

国際調査報告

国際出願番号 PCT/JPO2/03961

C(続き)	関連すると認められる文献	
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X	Ukr. Khim. Zh., (1984), 50(5), p. 530-4	1-4, 8-12, 16, 18
X	Ukr. Khim. Zh., (1981), 47(7), p. 735-8	1-3, 5, 8-13, 1 6, 19
X	Ukr. Khim. Zh., (1981), 47(3), p. 291-5	1-3, 5, 8-11, 1 6, 19
X	J. Heterocycl. Chem., (1978), 15(3), p. 369-75	1-3, 8-11, 16
X	Arch. Pharm., (1976), 309(5), p. 356-66	1-3, 8-11, 16
X	Z. Naturforsch., Teil B, (1973), 28(11-12), p. 801-4	1-3, 7, 16
X	Arzneim.-Forsch., (1973), 23(8), p. 1090-100	1-3, 8-11, 16
X	Chemical Abstracts, vol. 76, abs. no. 153482	1-3, 8-11, 16
X	Chemical Abstracts, vol. 72, abs. no. 132428	1-3, 8-12, 16
X	Chemical Abstracts, vol. 53, abs. no. 16106c-16107d	1-3, 8-11, 16
X	Chemical Abstracts, vol. 53, abs. no. 15082h-15085d	1-3, 8-11, 16
A	WO 98/37075 A1 (BOEHRINGER INGELHEIM PHARMA KG) 1998.08.27 & AU 9863991 A & DE 19751939 A & DE 19706229 A & ZA 9801275 A & NO 9903945 A & EP 966454 A1 & CN 1248251 A & SK 9901121 A & CZ 9902915 A & US 6087380 A & NZ 337323 A & BR 9807843 A & KR 2000071066 A & HU 200001116 A & JP 2001-509815 A	1-30
A	WO 99/40072 A1 (BOEHRINGER INGELHEIM PHARMA KG) 1999.08.12 & AU 9927201 A & DE 19804085 A & DE 19834325 A & US 6114532 A & EP 1060166 A1 & JP 2002-502844 A	1-30

国際調査報告

国際出願番号 PCT/JPO2/03961

第一欄 請求の範囲の一部の調査ができないときの意見（第1ページの2の続き）

法第8条第3項（PCT第17条(2)(a)）の規定により、この国際調査報告は次の理由により請求の範囲の一部について作成しなかった。

1. 請求の範囲 31, 32 は、この国際調査機関が調査をすることを要しない対象に係るものである。
つまり、

請求の範囲 31, 32 に記載された発明は、人体の治療による処置方法に該当する。

2. 請求の範囲 _____ は、有意義な国際調査をすることができる程度まで所定の要件を満たしていない国際出願の部分に係るものである。つまり、

3. 請求の範囲 _____ は、従属請求の範囲であって PCT 規則 6.4(a) の第 2 文及び第 3 文の規定に従って記載されていない。

第二欄 発明の単一性が欠如しているときの意見（第1ページの3の続き）

次に述べるようにこの国際出願に二以上の発明があるとこの国際調査機関は認めた。

1. 出願人が必要な追加調査手数料をすべて期間内に納付したので、この国際調査報告は、すべての調査可能な請求の範囲について作成した。

2. 追加調査手数料を要求するまでもなく、すべての調査可能な請求の範囲について調査することができたので、追加調査手数料の納付を求めなかった。

3. 出願人が必要な追加調査手数料を一部のみしか期間内に納付しなかったので、この国際調査報告は、手数料の納付のあった次の請求の範囲のみについて作成した。

4. 出願人が必要な追加調査手数料を期間内に納付しなかったので、この国際調査報告は、請求の範囲の最初に記載されている発明に係る次の請求の範囲について作成した。

追加調査手数料の異議の申立てに関する注意

追加調査手数料の納付と共に出願人から異議申立てがあった。
 追加調査手数料の納付と共に出願人から異議申立てがなかった。